

(19) AUSTRALIAN PATENT OFFICE

(54) Title
TRIAZOLOPYRIMIDINES, METHODS FOR THE PRODUCTION THEREOF, USE THEREOF FOR CONTROLLING HARMFUL FUNGI, AND SUBSTANCES CONTAINING SAID TRIAZOLOPYRIMIDINES

(51)⁶ International Patent Classification(s)
C07D 487/04 A01N 043/90

(21) Application No: **2003296662** (22) Application Date: **2003.12.17**

(87) WIPO No: **WO04/058765**

(30) Priority Data

(31) Number (32) Date (33) Country
102 61 189.0 2002.12.20 DE
7

(43) Publication Date : **2004.07.22**

(43) Publication Journal Date : **2004.08.26**

(71) Applicant(s)
BASF AKTIENGESELLSCHAFT

(72) Inventor(s)
MULLER, Bernd; TORMO I BLASCO, Jordi; GROTE, Thomas; BLETNER, Carsten; GEWEHR, Markus; GRAMMENOS, Wassilios; GYPSE, Andreas; RHEINHEIMER, Joachim; SCHAFER, Peter; SCHIEWECK, Frank; SCHWOGLER, Anja; AMMERMAN, Eberhard; STRATHMAN, Siegfried; SCHOF, Ulrich; STIERL, Reinhard

TRIAZOLOPYRIMIDINES, METHODS FOR THE PRODUCTION THEREOF, USE THEREOF FOR CONTROLLING HARMFUL FUNGI, AND SUBSTANCES CONTAINING SAID TRIAZOLOPYRIMIDINES

Description of corresponding document: **WO2004058765**

<Desc/Cims Page number 1>

Triazolopyrimidine, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schädlingen sowie sie enthaltende Mittel Beschreibung Die vorliegende Erfindung betrifft Triazolopyrimidine der Formel

EMI1.1

in der Index und die Substituenten die folgende Bedeutung haben : n 0 oder eine ganze Zahl von 1 bis 5 ; L Halogen, Cyano, Hydroxy, Cyanato (OCN), C1-C8-Alkyl, C2-C10-Alkenyl, C2-C10-Alkyl, C1-C6-Alkoxy, C2-C10-Alkenyl- oxy, C2-C10-Alkyl- oxy, C3-C6-Cycloalkyl, C3-C6-Cycloalkenyl, C3-C6-Cycloalkoxy, ein fünf-bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, ent- haltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe 0, N oder S ; - C (=O)-A, -C (=O)-O-A, -C (=O)-N (A') A, C (A') (=N-OA), N (A') A, N (A')-C (=O)-A, N (A'')-C (=O)-N (A') A, oder S (=O) m-A, m 0, 1 oder 2 ;

A, A', A'' unabhängig voneinander Wasserstoff, C1-C6-Al- kyl, C2-C6-Alkenyl, C2-C6-Alkyl, C3-C8-Cycloalkyl, C3-C8-Cycloalkenyl, wobei die organischen Reste partiell oder vollständig halogeniert sein können oder durch Cyano oder Cl-C4-Alkoxy substituiert sein können ; R1 Cl-Clo-Alkyl, C2-Clo-Alkenyl, C2-C10-Alkyl, C3-C12-Cycloalkyl, C3-C10-Cycloalkenyl, Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf-bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aro- matischer über Kohlenstoff gebundener Heterocyclus, enthal- tend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe 0, N oder S, wobei L und/oder R1 partiell oder vollständig halogeniert oder durch eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen Ra substituiert sein können : Ra Halogen, Cyano, Cl-C6-Alkyl, C3-C6-Cycloalkyl, C5-C6-Cy- cloalkenyl, Cl-C6-Alkoxy, Cl-C6-Alkylthio, C2-C6-Alkenyl, C2-C6-Alkenyloxy, C3-C6-Alkyl- oxy, C2-Clo-Alkyl, Phe-

<Desc/Cims Page number 2>

nyl, Naphthyl, fünf-bis zehngliedriger gesättigter, par- tiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, ent- haltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe 0, N oder S ; -C (=O)-A, -C (=O)-O-A, -C (=O)-N (A') A, C (A') (=N-OA), N (A') A, N (A')-C (=O)-A, N (A'')-C (=O)-N (A'') A, .. oder S (=O) m-A, wobei diese aliphatischen, alicyclischen oder aromati- schen Gruppen ihrerseits partiell. oder vollständig halo- geniert sein oder eine bis drei Gruppen Rb tragen können : Rb Halogen, Cyano, Nitro, Aminocarbonyl, Aminothiocarbo- nyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkyl- oxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Formyl, Alkylcarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfoxyl, Alkoxy carbonyl, Alkylcarbonyloxy, Al- kylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkylamino- thiocarbonyl, Dialkylaminothiocarbonyl, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten 1 bis 6 Kohlenstoff- atome enthalten und die genannten Alkenyl- oder Al- kylgruppen in diesen Resten 2 bis 8 Kohlenstoff- atome. enthalten; und/oder einen bis drei der folgenden Reste : Cycloalkyl, Cycloalkoxy, Heterocyclyl, Hetero- cycl- oxy, wobei die cyclischen Systeme 3 bis 10 Ringglieder enthalten ; Aryl, Aryloxy, Arylthio, Aryl- Cl-C6-alkoxy, .. Aryl- Cl-C6-alkyl, Hetaryl, Hetaryloxy, Hetarylthio, wobei die Arylreste vorzug- weise 6 bis 10 Ringglieder, die Hetarylreste 5 oder 6 Ringglieder enthalten, wobei die cyclischen Systeme partiell oder vollständig halogeniert oder durch Al- kyl- oder Haloalkylgruppen substituiert sein können ; und R2 Cl-C4-Alkyl, C2-C4-Alkenyl oder C2-C4-Alkyl, die durch Halo- gen, Cyano, Nitro, Cl-C2-Alkoxy oder Cl-C4-Alkoxy carbonyl sub- stituiert sein können ; sowie Cyano, Chlor, Methoxy ; R3 Halogen, Cyano, Cl-Cg-Alkyl, C1-C4-Halogenalkyl, Hydroxy, C1-C8-Alkoxy, C3-C8-Alkenyl, C3-Cg-Alkenyloxy, Cl-Cg-Halogenalkoxy, C3-C8-Halogenalkenyl, C3-C8-Cycloalkyl, N (A') A,

N (A')-C(=O)-A oder S(=O)m-A.

<Desc/Cims Page number 3>

Ausserdem betrifft die Erfindung Verfahren und Zwischenprodukte zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung-zur Bekämpfung vonpflanzenpathogenen. Schadpil-zen.

In 2-Stellung substituierte Triazolopyrimidine sind aus EP-A.

71 792, EP-A 141 317, WO 02/88126 und WO 02/88127 bekannt. Die in den. genannten Schriften beschriebenen Verbindungen sind zur Be- kämpfung von Schadpilzen geeignet.

Ihre Wirkung ist jedoch in vielen Fällen nicht zufriedenstellend.

Davon ausgehend, liegt der vorliegenden Erfindung die Aufgabe zu- grunde, Verbindungen mit verbesserter Wirkung und/oder verbrei- tertem Wirkungsspektrum bereitzustellen.

Demgemäss wurden die eingangs. definierten Verbindungen gefunden.

Desweiteren wurden Verfahren und. Zwischenprodukte zu ihrer Her- stellung, sie enthaltende Mittel sowie Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen unter Verwendung der Verbindungenl. gefunden.

Die Verbindungen der Formel I unterscheiden sich von den aus den oben genannten Schriften durch die Substituenten in der 5 und 7- Position amTriazolopyrimidinring.

Die Verbindungen der Formel I weisen eine gegenüber den bekannten Verbindungen erhöhte Wirksamkeit gegen pflanzenpathogene Schad- pilze auf.

Die erfindungsgemässen Verbindungen können auf verschiedenen Wegen erhalten werden. Vorteilhaft werden sie durch Umsetzung von Sul- fonen der Formel I unter basischen Bedingungen. mit Verbindungen der Formel II erhalten. Verbindungen II stellen je nach Ausge- staltung der Gruppe R3 entweder a) Cyanide, Hydroxide, Alkoholate oder Amine dar. In diesen Fällen stellt das Kation M in Formel II üblicherweise ein Ammonium-, Tetraalkylammonium-oder Alkali- oder Erdalkalimetallion dar. Für den Fall b), dass R3 Alkyl oder insbesondere Fluoralkyl bedeutet, steht M für ein Metallion der Wertigkeit Y, wie beispielsweise B, Si, Zn, Mg, oder Sn.

EMI3.1

Ri/Ri/

NN \ 'i(R3) Y r2Y ill) NN ' RS02-R ?

N R 11 N R'i

I'l r 1

<Desc/Cims Page number 4>

Im Fall a) erfolgt die Umsetzung üblicherweise bei Temperaturenvon.-20 C bis120 C, vorzugsweise 0 C bis25 C, in einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Base[vgl. Heteroat.

Chem.S. 313(2000)].

Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische oder aromatische Koh- lenwasserstoffe wie Benzol, Toluol, o-, m-und p-Xylol, haloge- nierte Kohlenwasserstoffe, Ether wie Diethylether,Diisopropyle- ther, tert. - Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, Nitrile, Ketone, Alkohole sowie Dimethylsulfoxid,Dimethylforma- mid und Dimethylacetamid, besonders bevorzugt Dimethylsulfoxid, Dioxan und Benzol. Es können auch Gemische der genannten Lösungs- mittel verwendet werden.

Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkali- metall-und Erdalkalimetallhydride wie Lithiumhydrid, Natriumhy- drid, Kaliumhydrid und Calziumhydrid, ausserdem organische Basen, z. B.

tertiäre Amine sowie bicyclische Amine in Betracht. Besonders bevorzugt wird Natriumhydrid. Die Basen werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt, sie können aber auch äquimolar, im Überschuss oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet werden.

Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann für die Ausbeute vorteilhaft sein, II in einem Überschuss bezogen auf I einzusetzen.

Die bevorzugten Thiole der Formel I lassen sich ebenfalls aus den Sulfonen I' gewinnen. Die Umsetzung wird analog wie oben beschrieben mit einem Alkali- oder Erdalkalisulfid oder -hydrogensulfid oder mit Schwefelwasserstoff in Gegenwart von Basen durchgeführt. Insbesondere hat sich Natriumsulfid und Natriumhydrogensulfid als für die Reaktion geeignet erwiesen. Die freie SH-Verbindung kann mittels Säure aus den Thiolat-Salzen gewonnen werden.
EMI4.1

Ri/Ri' "MSH I Ia)"r, RSO \ FiS

Base-

I' Ia Die Reaktion im Fall b) kann beispielsweise analog folgender Methoden durchgeführt werden : J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 1187 (1994), ebenda, 2345 (1996) ; WO-A 99/41255 ; Aust. J. Chem., Bd.

43,733 (1990) ; J. Org. Chem., Bd. 43,358 (1978) ; J. Chem. Soc.

Chem. Commun. 866 (1979) ; Tetrahedron Lett., Bd. 34,8267 (1993) ;

<Desc/Cims Page number 5>

ebenda, Bd. 33,413(1992). Unter Umständen kann es vorteilhaft sein, die Reaktion unter Pd- oder Ni-Katalyse durchzuführen.

Sulfone der Formel I' werden bevorzugt durch Oxidation der entsprechenden Thioverbindungen I' erhalten. In Formel I' haben die Variablen die Bedeutung wie in Formel I. Ihre Herstellung erfolgt unter den aus WO 02/88127 bekannten Bedingungen. Als Oxidationsmittel haben sich insbesondere Wasserstoffperoxid oder Persäuren organischer Carbonsäuren bewährt. Die Oxidation kann jedoch auch beispielsweise mit Selenoxid durchgeführt werden.
EMI5.1

Ri. Ri/ .p L. (oxid.). L.

NN \ RS-- ~y, -- RSOai

N\Ra'N'Jw IIN'N"Rz

R R Verbindungen der Formel I, in denen R3 für Cl-C8-Alkyl, Cl-C4-Halogenalkyl, SH oder Cl-C6-Alkylthio steht, können vorteilhaft über folgenden Syntheseweg erhalten werden :

EMI5.2

Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 80 C bis 250 C, vorzugsweise 120 C bis 180 C, ohne Solvens oder in einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Base [vgl. EP-A 770615] oder in Gegenwart von Essigsäure unter den aus Adv. Het. Chem. Bd. 57, S.81ff. (1993) bekannten Bedingungen.

Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe, Ether, Nitrile, Ketone, Alkohole, sowie N-Methylpyrrolidon, Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid. Besonders bevorzugt wird die Umsetzung ohne Lösungsmittel oder in Chlorbenzol, Xylol, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon durchgeführt. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkali- und Erdalkalimetallhydroxide, Alkalimetall- und Erdalkalimetall-oxide, Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride, Alkali- metallamide, Alkalimetall- und Erdalkalimetallcarbonate sowie Alkalimetallhydrogencarbonate, metallorganische Verbindungen, insbesondere Alkalimetallalkyle, Alkylmagnesiumhalogenide sowie Al-

<Desc/Cims Page number 6>

kalimetall- und Erdalkalimetallalkoholate und Dimethoxymagnesium, ausserdem organische Basen, z. B. tertiäre Amine wie Trimethylamin, Triethylamin, Di-isopropylethylamin, Tributylamin und N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, Pyridin, substituierte Pyridine wie Collidin, Lutidin und 4-Dimethylaminopyridin sowie bicyclische Amine in Betracht. Besonders bevorzugt werden tertiäre Amine wie Di-isopropylethylamin, Tributylamin, N-Methylmorpholin oder N-Methylpiperidin.

Die Basen werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt, sie können aber auch äquimolar, im Überschuss oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet werden.

Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann für die Ausbeute vorteilhaft sein, die Base und das Diketon IV in einem Überschuss bezogen auf III einzusetzen.

Die Aminotriazole der Formel III sind beispielsweise aus EP-A 71 792, EP-A 141 317, WO 02/088126 und WO02/088127 bekannt.

3-Methylthio-5-aminotriazol ist auch käuflich erwerblich. Die Dicarbonylverbindungen der Formel IV sind in der Literatur beschrieben bzw. können nach analogen Verfahren hergestellt werden (J. Am. Chem. Soc., 122, 1360 (2000); Org. Lett., 2, 1045 (2000); Synthetic Commun., 17, 393 (1987); Bull. Soc. Chim. FR., 3, 438 (1987); Tetrahedron Lett., 30, 1373 (1989); J. Med. Chem., 35, 931 (1992); Tetrahedron, 48, 6909 (1992); J. Org. Chem., 44, 4021 (1979).

Als besonders interessante Ausführungsform des o. g. Verfahrens geht von Triazolen der Formel IIIa aus, EMI6.1

in der R für Wasserstoff, C1-C6-Alkyl oder ggf. substituiertes Phenyl steht, mit Dicarbonylverbindungen der Formel IV, EMI6.2

in der n, L, R1 und R2 die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben, zu Triazolopyrimidinsulfiden der Formel II,

<Desc/Cls Page number 7>

EMI7.1

und ggf. Oxidation von I zu Sulfonen der Formel I'. Der Sulfonylrest kann ggf. wie weiter oben ausgeführt gegen andere Reste R3 ausgetauscht werden.

Die erfindungsgemässen Verbindungen I, in denen R3 SH bedeutet, können durch Umsetzung von 3-Thio-5-aminotriazol der Formel III', in der R1 für Wasserstoff oder eine unter sauren oder, bevorzugt, unter basischen Bedingungen abspaltbare Schutzgruppe steht, wie Methyl, ggf. subst. Phenyl, Benzyl, insbesondere p-Acetoxybenzyl [vgl. Greene, Protective Groups in Organic Chemistry, J. Wiley & Sons, S. 195-217 (1981); J. Org. Chem., Bd. 43, S. 1197 (1978)], mit entsprechend substituierten Phenylmalonaten der Formel IV hergestellt werden.

EMI7.2

Die Kondensation kann analog dem o. g. Verfahren durchgeführt werden.

3-Thio-5-aminotriazole der Formel II sind bekannt und z. T. kommerziell erhältlich. Die Einführung der Schutzgruppe II in Verbindung III sowie die Abspaltung der Schutzgruppe II in der Zwischenverbindung I kann analog den in Greene, Protective Groups in Organic Chemistry, J. Wiley & Sons, S. 195-217 (1981) beschriebenen Verfahren durchgeführt werden.

Eine weitere Möglichkeit die Verbindungen I herzustellen, ist im folgenden Schema aufgeführt.

EMI7.3

Ausgehend von den Ketoestern V werden die 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriaazolopyrimidine VI erhalten. In Formel V steht R2 für C1-C4-Alkyl oder C1-C4-Halogenalkyl. Durch Verwendung der leicht zugänglichen 2-Phenylacetessigester (V mit R2=CH3) werden die 5-Methyl-7-hydroxy-6-phenyltriaazolopyrimidine

erhalten [vgl.

<Desc/Cims Page number 8>

Chem. Pharm.Bull., 9,801,(1961).]. Die Herstellung der Ausgangsverbindungen V erfolgt vorteilhaft unter den aus EP-A 10 02 788 beschriebenen Bedingungen.

Die so erhaltenen 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidine werden mit Halogenierungsmitteln zu 7-Halogenotriazolopyrimidinen umgesetzt. Bevorzugt werden Chlorierungs-oder Bromierungsmittel wie Phosphoroxybromid, Phosphoroxychlorid, Thionylchlorid, Thionylbromid oder Sulfurylchlorid eingesetzt. Die Umsetzung kann in Substanz oder in Gegenwart eines Lösungsmittels durchgeführt werden. Übliche Reaktionstemperaturen betragen von 0 bis 150 C oder vorzugsweise von 80 bis 125 C [vgl. EP-A 770 615].

Bei den so erhaltenen 5-Alkyl-7-halogen-6-phenyltriazolopyrimidinen können mittels metallorganischer B-, Zn-, Mg-oder Sn-Verbindungen der jeweilige Rest R₂ in 7-Stellung eingeführt werden. Unter Umständen kann es vorteilhaft sein, die Reaktion unter Pd-oder Ni-Katalyse durchzuführen. Die Reaktion kann beispielsweise analog folgender Methoden durchgeführt werden : J. Chem. Soc. Per-kin Trans. 1, 1187 (1994), ebenda, 2345 (1996) ; WO-A 99/41255 ; Aust. J. Chem., Bd. 43,733 (1990) ; J. Org. Chem., Bd. 43, 358(1978) ; J. Chem. Soc.. Chem. Commun.866 (1979) ; Tetrahedron Lett., Bd. 34,8267 (1993); ebenda, Bd. 33, 413 (1992).

Die erfindungsgemässen Verbindungen der Formel I sind auch zugänglich durch Umsetzung von 5-Halogenotriazolopyrimidinen der Formel VII mit substituierten Malonsäureestern der Formel VIII, in der R_x für Cl-C₄-Alkyl, Allyl, Phenyl oder Benzyl steht, anschliessender Verseifung des entstandenen Esters IX und Decarboxylierung der Carbonsäure IXa.
EMI8.1

<Desc/Cims Page number 9>

In Formel VII steht X für Halogen, insbesondere für Chlor oder Brom. Die Verbindungen VII sind aus den eingangs zitierten Schriften bekannt. In Formel I haben n, R und R₁ die für Formel 1 definierte Bedeutung und RA steht für Wasserstoff oder Cl-C₃-Alkyl, das durch Halogen, Cyano, Nitro oder Cl-C₂-Alkoxy substituiert sein kann.

In einer bevorzugten Ausführungsform des erfindungsgemässen Verfahrens bedeutet RA. Wasserstoff oder Methyl, insbesondere Wasserstoff.

Die Ausgangsstoffe VIII sind in der Literatur bekannt [J. Am.

Chem. Soc., Bd. 64,2714 (1942) ; J. Org. Chem., Bd. 39, 2172 (1974) ; Helv. Chim. Acta, Bd. 61,1565 (1978)] oder können gemäss der zitierten Literatur hergestellt werden.

Die anschliessende Spaltung des Esters erfolgt unter den allgemein. üblichen Bedingungen [vgl. : Greene & Wuts, Protective Groups in Organic Synthesis, Wiley (1991), S. 224 ff : Spaltung von Alkyl-estern unter Pd-Katalyse (S. 248) ; hydrierende Spaltung von Benzylestern (S. 251) ; Spaltung von Methyl- bzw. Ethylestern in Gegenwart von Lithiumsalzen, wie LiI (S. 232), LiBr oder LiCl ; oder unter sauren oder alkalischen Bedingungen]. In Abhängigkeit der Strukturelemente RA, R_n und R₁ kann die alkalische oder die saure Verseifung der Verbindungen IX vorteilhaft sein. Unter den Bedingungen der Esterverseifung kann die Decarboxylierung zu I bereits ganz oder teilweise erfolgen.

Die Decarboxylierung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 20 C bis 180 C, vorzugsweise 50 C bis 120 C, in einem inerten Lösungsmittel, gegebenenfalls in Gegenwart einer Säure.

Geeignete Säuren sind Salzsäure, Schwefelsäure, Phosphorsäure, Ameisensäure, Essigsäure, p-Toluolsulfonsäure. Geeignete Lösungsmittel sind Wasser, aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan,

Hexan, Cyclohexan und. Petrolether, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-,m-und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether ; tert. -Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Diethylketon und tert. -Butylmethylether, Alkohole wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, Isopropanol, n-Butanol und tert. -Butanol, sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid, besonders bevorzugt wird die Reaktion in Salzsäure oder Essigsäure durchgeführt. Es

<Desc/Cims Page number 10>

können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

Ein weiterer Zugang zu den Verbindungen der Formel I wird in den folgenden Abschnitten beschrieben : Ausgehend von 3-Thiomethyl-5-aminotriazol der Formel IIIa werden mit entsprechend substituierten Phenylmalonaten der Formel X, in der R für Alkyl, bevorzugt für C1-C6-Alkyl, insbesondere für Methyl oder Ethyl steht, die Dihydroxytriazolopyrimidine XI dargestellt. Analog lassen sich ausgehend von 3-Alkyl-5-aminosubstituierten Triazolen die entsprechenden 2-Alkylsubstituierten Dihydroxytriazolopyrimidine herstellen.

EMI10.1

Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 80 C bis 250 C, vorzugsweise 120 C bis 180 C, ohne Solvens oder in einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Base [vgl. EP-A 770615] oder in Gegenwart von Essigsäure unter den aus Adv. Het. Chem. Bd. 57, S.81ff. (1993) bekannten Bedingungen.

Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe, Ether, Nitrile, Ketone, Alkohole, sowie N-Methylpyrrolidon, Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid. Besonders bevorzugt wird die Umsetzung ohne Lösungsmittel oder in Chlorbenzol, Xylol, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon durchgeführt. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

Als Basen kommen insbesondere organische Basen, z. B. tertiäre Amine wie Trimethylamin, Triethylamin, Diisopropylethylamin, Tributylamin und N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, Pyridin, substituierte Pyridine wie Collidin, Lutidin und 4-Dimethylaminopyridin sowie bicyclische Amine in Betracht. Besonders bevorzugt werden tertiäre Amine wie Diisopropylethylamin, Tributylamin, N-Methylmorpholin oder N-Methylpiperidin. Die Basen werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt, sie können aber auch äquimolar, im Überschuss oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet werden.

<Desc/Cims Page number 11>

Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann für die Ausbeute vorteilhaft sein, die Base und das Malonat XV in einem Überschuss bezogen auf das Triazol XIV einzusetzen.

3-Thiomethyl-5-aminotriazol der Formel IIIa ist kommerziell erhältlich. Phenylmalonate der Formel X werden vorteilhaft aus der Reaktion entsprechend substituierter Brombenzole mit Dialkylmalonaten unter Cu(I)-Katalyse erhalten [vgl. Chemistry Letters, S.

367-370 (1981) ; EP-A 10 02 788].

Die Dihydroxytriazolopyrimidine der Formel XI werden unter den aus WO 94/20501 bekannten Bedingungen in die Dihalogenpyrimidine der Formel XII überführt. Als Halogenierungsmittel wird vorteilhaft ein Chlorierungsmittel oder ein Bromierungsmittel, wie Phosphoroxylbromid oder Phosphoroxylchlorid, ggf. in Anwesenheit eines Lösungsmittels, eingesetzt.

EMI11.1

Diese Umsetzung wird üblicherweise bei 0 C bis 150 C, bevorzugt bei 80 C bis 125 C, durchgeführt [vgl. EP-

A 770 615].

Ausgehend von den Dihalogenpyrimidine der Formel XII können durch Kupplung mit metallorganischen Reagenzien der Formel II der Substituent R1 in 7-Stellung eingeführt und damit die Verbindungen der Formel VII erhalten werden. In einer Ausführungsform dieses Verfahrens erfolgt die Umsetzung unter Übergangsmetallkatalyse, wie Ni- oder Pd-Katalyse.
EMI11.2

In Formel II steht M für ein Metallion der Wertigkeit Y, wie beispielsweise B, Zn, Mg oder Sn. Diese Reaktion kann beispielsweise analog folgender Methoden durchgeführt werden : J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 1187 (1994), ebenda, 2345 (1996) ; WO-A 99/41255 ; Aust. J. Chem., Bd. 43, 733 (1990) ; J. Org. Chem., Bd. 43, 358 (1978) ; J. Chem. Soc. Chem. Commun. 866 (1979) ; Tetrahedron Lett., Bd. 34, 8267 (1993) ; ebenda, Bd. 33, 413 (1992).

<Desc/Cims Page number 12>

Die Reaktionsgemische werden in üblicher Weise aufgearbeitet, z. B. durch Mischen mit Wasser, Trennung der Phasen und gegebenenfalls chromatographische Reinigung der Rohprodukte. Die Zwischen- und Endprodukte fallen z. T. in Form farbloser oder schwach bräunlicher, zäher Öle an, die unter vermindertem Druck und bei mässig erhöhter Temperatur von flüchtigen Anteilen befreit oder gereinigt werden. Sofern die Zwischen- und Endprodukte als Feststoffe erhalten werden, kann die Reinigung auch durch Umkristallisieren oder Digerieren erfolgen.

Sofern einzelne Verbindungen 1 nicht auf den voranstehend beschriebenen Wegen zugänglich sind, können sie durch Derivatisierung anderer Verbindungen I hergestellt werden.

Sofern bei der Synthese Isomerengemische anfallen, ist im allgemeinen jedoch eine Trennung nicht unbedingt erforderlich, da sich die einzelnen Isomere teilweise während der Aufbereitung für die Anwendung oder bei der Anwendung (z. B. unter Licht-, Säure- oder Baseneinwirkung) ineinander umwandeln können. Entsprechende Umwandlungen können auch nach der Anwendung, beispielsweise bei der Behandlung von Pflanzen in der behandelten Pflanze oder im zu bekämpfenden Schadpilz erfolgen.

Bei den in den vorstehenden Formeln angegebenen Definitionen der Symbole wurden Sammelbegriffe verwendet, die allgemein repräsentativ für die folgenden Substituenten stehen : Halogen : Fluor, Chlor, Brom und Jod ; Alkyl : gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen, z. B.

CI-C6-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, Isomethylpropyl, 2-Methylpropyl, 1, 1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Dimethylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1, 1-Dimethylpropyl, 1, 2-Dimethylpropyl.

1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1, 1-Dimethylbutyl, 1, 2-Dimethylbutyl, 1, 3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3, 3-Dimethylbutyl, Isomethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1, 1,2-Trimethylpropyl, 1,2, 2-Trimethylpropyl, 1-Ethylisomethylpropyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl ; Halogenalkyl : geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen teilweise oder vollständig die Wasserstoffatome durch Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können, z. B.

CI-C2-Halogenalkyl wie Chlormethyl, Brommethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl,

Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 1-Chlorethyl, 1-Bromethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2, 2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2, 2-Trichlorethyl, Pentafluorethyl oder 1, 1, 1-Trifluorprop-2-yl ; Alkenyl : ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen und

einer Doppelbindung in einer beliebigen Position, z. B. C2-C6-Alkenyl wie Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-1-butenyl, 2-Methyl-1-butenyl, 3-Methyl-1-butenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2-butenyl, 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1, 2-Dimethyl-1-propenyl, 1, 2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl,

Alkinyl : geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 2 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen Position, z. B. C2-C6-Alkinyl wie Ethinyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1, 1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl, 2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-1-pentinyl, 3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl, 1, 1-Dimethyl-2-butinyl, 1, 1-Dimethyl-3-butinyl, 1, 2-Dimethyl-3-butinyl, 2, 2-Dimethyl-3-butinyl, 3, 3-Dimethyl-1-butinyl, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl ; Cycloalkyl : mono- oder bicyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 6 oder 8 Kohlenstoffringgliedern, z. B.

C3-C8-Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl und Cyclooctyl ; fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S : - 5- oder 6-gliedriges Heterocyclyl, enthaltend ein bis drei

Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein oder zwei Sauerstoff- und/oder Schwefelatome, z. B. 2-Tetrahydrofuran-yl, 3-Tetrahydrofuran-yl, 2-Tetrahydrothien-yl, 3-Tetrahydrothien-yl, 2-Pyrrolidin-yl, 3-Pyrrolidin-yl, 3-Isoxazolidin-yl, 4-Isoxazolidin-yl, 5-Isoxazolidin-yl, 3-Isotiazolidin-yl, 4-Isotiazolidin-yl, 5-Isotiazolidin-yl, 3-Pyrazolidin-yl, 4-Pyrazolidin-yl, 5-Pyrazolidin-yl, 2-Oxazolidin-yl, 4-Oxazolidin-yl, 5-Oxazolidin-yl, 2-Thiazolidin-yl, 4-Thiazolidin-yl, 5-Thiazolidin-yl, 2-Imidazolidin-yl, 4-Imidazolidin-yl, 1,2, 4-Oxadiazolidin-3-yl, 1,2, 4-Oxadiazolidin-5-yl, 1,2, 4-Thiadiazolidin-3-yl, 1,2, 4-Thiadiazolidin-5-yl, 1, 2, 4-Triazolidin-3-yl, 1,3, 4-Oxadiazolidin-2-yl, 1,3, 4-Thiadiazolidin-2-yl, 1, 3, 4-Triazolidin-2-yl, 2,3-Dihydrofur-2-yl, 2,3-Dihydrofur-3-yl, 2,4-Dihydrofur-2-yl, 2,4-Dihydrofur-3-yl, 2,3-Dihydrothien-2-yl, 2, 3-Dihydrothien-3-yl, 2,4-Dihydrothien-2-yl, 2, 4-Dihydrothien-3-yl, 2-Pyrrolin-2-yl, 2-Pyrrolin-3-yl, 3-Pyrrolin-2-yl, 3-Pyrrolin-3-yl, 2-Isoxazolin-3-yl, 3-Isoxazolin-3-yl, 4-Isoxazolin-3-yl, 2-Isoxazolin-4-yl, 3-Isoxazolin-4-yl, 4-Isoxazolin-4-yl, 2-Isoxazolin-5-yl, 3-Isoxazolin-5-yl, .

4-Isoxazolin-5-yl, 2-Isotiazolin-3-yl, 3-Isotiazolin-3-yl, 4-Isotiazolin-3-yl, 2-Isotiazolin-4-yl, 3-Isotiazolin-4-yl, 4-Isotiazolin-4-yl, 2-Isotiazolin-5-yl, 3-Isotiazolin-5-yl,

<Desc/Cls Page number 15>

4-Isotiazolin-5-yl, 2,3-Dihydropyrazol-1-yl, 2, 3-Dihydropyrazol-2-yl, 2,3-Dihydropyrazol-3-yl, 2,3-Dihydropyrazol-4-yl, 2,3-Dihydropyrazol-5-yl, 3, 4-Dihydropyrazol-1-yl, 3,4-Dihydropyrazol-3-yl, 3, 4-Dihydropyrazol-4-yl, 3,4-Dihydropyrazol-5-yl, 4, 5-Dihydropyrazol-1-yl, 4,5-Dihydropyrazol-3-yl, 4,5-Dihydropyrazol-4-yl, 4,5-Dihydropyrazol-5-yl, 2,3-Dihydrooxazol-2-yl, 2,3-Dihydrooxazol-3-yl, 2,3-Dihydrooxazol-4-yl, 2,3-Dihydrooxazol-5-yl, 3,4-Dihydrooxazol-2-yl, 3,4-Dihydrooxazol-3-yl, 3,4-Dihydrooxazol-4-yl, 3,4-Dihydrooxazol-5-yl, 2-Piperidin-yl, 3-Piperidin-yl, 4-Piperidin-yl, 1, 3-Dioxan-5-yl, 2-Tetrahydropyran-yl, 4-Tetrahydropyran-yl, 2-Tetrahydrothien-yl, 3-Hexahydropyridazin-yl, 4-Hexahydropyridazin-yl,

EMI16.1

in der Index und die Substituenten die folgende Bedeutung haben : n 0 oder eine ganze Zahl von 1 bis 5 ; L Halogen, Cyano, Hydroxy, Cyanat (OCN), Cl-Cg-Alkyl, C2-C10-Alkenyl, C2-C10-Alkinyl, Cl-C6-Alkoxy, C2-C10-Alkenyl-oxy, C2-C10-Alkinyloxy, C3-C6-Cycloalkyl, C3-C6-Cycloalkenyl, C3-C6-Cycloalkoxy, ein fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis

vier Heteroatome. aus der Gruppe O, N oder S ; - C (=O)-A, -C (=O)-O-A, -C (=O)-N (A') A, C (A') (=N-OA), N (A') A, N (A')-C (=O)-A, N (A'')-C (=O)-N (A') A, oder S (=O)m-A, m 0, 1 oder 2; A, A', A'' unabhängig voneinander Wasserstoff, C1-C6-Alkyl, C2-C6-Alkenyl, C2-C6-Alkiny, C3-C8-Cycloalkyl, C3-C8-Cycloalkenyl, wobei die organischen Reste partiell oder vollständig halogeniert sein können oder durch Cyano oder Cl-C4-Alkoxy substituiert sein können ; R1 C1-C10-Alkyl, C2-C10-Alkenyl, C2-C10-Alkiny, C3-C12-Cycloalkyl, C3-C10-Cycloalkenyl, Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf-bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer über Kohlenstoff gebundener Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, wobei L und/oder R1 partiell oder vollständig halogeniert oder durch eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen Ra substituiert sein können : Ra Halogen, Cyano, Cl-C6-Alkyl, C3-C6-Cycloalkyl, C5-C6-Cycloalkenyl, C1-C6-Alkoxy, C1-C6-Alkylthio, C2-C6-Alkenyl, C2-C6-Alkenyloxy, C3-C6-Alkinyloxy, C2-Clo-Alkiny, Phenyl, Naphthyl, fünf-bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S ; -C (=O)-A, -C (=O)-O-A, -C (=O)-N (A') A, C (A') (=N-OA), N (A') A, N (A') -C (=O)-A, N (A'') -C (=O)-N (A') A, oder S (=O)m-A,

<Desc/Cims Page number 17>

wobei diese aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen Rb tragen können : Rb Halogen, Cyano, Nitro, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Formyl, Alkylcarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfoxyl, Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkylaminothiocarbonyl, Dialkylaminothiocarbonyl, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten und die genannten Alkenyl- oder Alkinygruppen in diesen Resten 2 bis 8 Kohlenstoffatome enthalten ; und/oder einen bis drei der folgenden Reste : Cycloalkyl, Cycloalkoxy, Heterocyclyl, Heterocyclioxy, wobei die cyclischen Systeme 3 bis 10 Ringglieder enthalten ; Aryl, Aryloxy, Arylthio, Aryl-Cl-C6-alkoxy, Aryl-Cl-C6-alkyl, Hetaryl, Hetarylloxy, Hetarylthio, wobei die Arylreste vorzugsweise 6 bis 10 Ringglieder, die Hetarylreste 5 oder 6 Ringglieder enthalten, wobei die cyclischen Systeme partiell oder vollständig halogeniert oder durch Alkyl- oder Haloalkylgruppen substituiert sein können ; und R2 Cl-C4-Alkyl, C2-C4-Alkenyl oder C2-C4-Alkiny, die durch Halogen, Cyano, Nitro, Cl-C2-Alkoxy oder Cl-C4-Alkoxy carbonyl substituiert sein können ; sowie Cyano, Chlor, Methoxy ; R3 Cyano, C1-C8-Alkyl, C1-C4-Halogenalkyl, Hydroxy, Cl-C8-Alkoxy, C3-C8-Alkenyl, C3-C8-Alkenyloxy, Cl-Cg-Halogenalkoxy, C3-Cg-Halogenalkenyloxy, C3-C8-Cycloalkyl, N (A') A, N (A')-C (=O)-A oder S (=O)m-A.

Triazolopyrimidine nach Anspruch 1, in der Index und die Substituenten die folgende Bedeutung haben : L Halogen, Cyano, C1-C8-Alkyl, C2-C10-Alkenyl, C2-C10-Alkiny, Cl-C6-Alkoxy, C2-Clo-Alkenyloxy, C2-C1p-Alkinyloxy, C3-C6-Cycloalkyl, C3-C6-Cycloalkenyl, C3-C6-Cycloalkoxy, -C (=O)-A, -C (=O)-O-A, -C (=O)-N (A') A, C (A') (=N-OA), N (A') A, N (A')-C (=O)-A, N (A'')-C (=O)-N (A') A, oder S (=O)m-A,

<Desc/Cims Page number 18>

m 0, 1 oder 2 ;

A, A', A'' unabhängig voneinander Wasserstoff, C1-C6-Alkyl, C2-C6-Alkenyl, C2-C6-Alkiny, C3-Cg-Cycloalkyl, C3-C8-Cycloalkenyl, wobei die organischen Reste partiell oder vollständig halogeniert sein können oder durch Cyano oder Cl-C4-Alkoxy substituiert sein können ; R1 Cl-Clo-Alkyl, C2-Clo-Alkenyl, C2-Clo-Alkiny, C3-C12-Cycloalkyl, C3-Clo-Cycloalkenyl oder ein fünf-bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer über Kohlenstoff gebundener Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, wobei L und/oder R1 partiell oder vollständig halogeniert oder durch eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen Ra substituiert sein können : Ra Halogen, Cyano, Cl-C6-Alkyl, C3-C6-Cycloalkyl, C5-C6-Cycloalkenyl, Cl-C6-Alkoxy, Cl-C6-Alkylthio, C2-

C6-Alkenyl,
 C2-C6-Alkenyloxy, C3-C6-Alkinyloxy, C2-Clo-Alkynyl, Phe- nyl, Naphthyl, fünf- bis zehngliedriger gesättigter, par- tiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, ent- haltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S ; -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N (A') A, C(A') (=N-OA), N(A') A, N (A')-C(=O)-A, N (A'')-C(=O)-N (A') A, oder S(=O)_m-A, wobei diese aliphatischen, alicyclischen oder aromati- schen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halo- geniert sein oder eine bis drei Gruppen Rb tragen können :
 Rb Halogen, Cyano, Nitro, Aminocarbonyl, Aminothiocarbo- nyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkynyl- oxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfoxy, Alkoxy- carbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkylaminocarbonyl, Dial- kylaminocarbonyl, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten und die ge- nannten Alkenyl-oder Alkynylgruppen in diesen Resten 2 bis 8 Kohlenstoffatome enthalten ; und/oder einen bis drei der folgenden Reste :
 Cycloalkyl, Cycloalkoxy, Heterocyclyl, Hetero- cyclyloxy, wobei die cyclischen Systeme 3 bis 10 Ringglieder enthalten ; Aryl, Aryloxy, Arylthio,

<Desc/Cims Page number 19>

Aryl-CI-C6-alkoxy, Aryl-C1-C6-alkyl, Hetaryl, Hetaryloxy, Hetarylthio, wobei die Arylreste vorzugs- weise 6 bis 10 Ringglieder, die Hetarylreste 5 oder 6 Ringglieder. enthalten, wobei die cyclischen Systeme partiell oder vollständig halogeniert oder durch Al- kyl-oder Haloalkylgruppen substituiert sein können ; und R2CI-C4-Alkyl, das durch Halogen, Cyano, Nitro, CI-C2-Alkoxy oder CI-C4-Alkoxy carbonyl substituiert sein kann.

Triazolopyrimidine, in der Index und die Substituenten die fol- gende Bedeutung haben : AlCI-Clo-Alkyl, C2- Clo-Alkenyl, C2-Clo-Alkynyl, C3-C12-Cycloalkyl oder C3-Clo-Cycloalkenyl, wobei Lund/oder R1 partiell oder vollständig halogeniert oder durch eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen Ra substituiert sein können :
 Ra Halogen, Cyano, CI-C6-Alkyl, C3-C6-Cycloalkyl, C5-C6-Cy- cloalkenyl, CI-C6-Alkoxy, CI-C6-Alkylthio, C2-C6-Alkenyl,

C2-C6-Alkenyloxy, C3-C6-Alkinyloxy, C2-C10-Alkynyl, -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N (A') A, C(A') (=N-OA), N (A') A, N(A')-C(=O)-A, N(A'')-C(=O)-N (A') A, oder S (=O) ja-A, wobei diese aliphatischen, alicyclischen oder aromati- schen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halo- geniert sein oder eine bis drei Gruppen Rb tragen können :
 Rb Halogen, Cyano, Aminocarbonyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylcarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfoxy, Alkoxy carbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, wobei die Alkylgruppen in die- sen Resten 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten und die genannten Alkenyl- oder Alkynylgruppen in diesen Re- sten 2 bis 8 Kohlenstoffatome enthalten.

R2CI-C4-Alkyl, das durch Halogen, Cyano, Nitro, CI-C2-Alkoxy oder CI-C4-Alkoxy carbonyl substituiert sein kann.

<Desc/Cims Page number 20>

Die besonders bevorzugten Ausführungsformen der Zwischenprodukte in Bezug auf die Variablen entsprechen denen der Reste R1, R2 und R3 der Formel I. Im Hinblick auf ihre bestimmungsgemäße Verwendung der Triazolopy- rimidine der Formel I sind die folgenden Bedeutungen der Substi- tuenten, und zwar jeweils für sich. allein oder in Kombination, besonders bevorzugt : Verbindungen I werden bevorzugt, in denen R1 für C3-C8-Alkyl, C3-C8-Alkenyl, C3-C8-Alkynyl, C3-C6-Cycloalkyl oder C5-C6-Cycloal- kenyl steht.

Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R1 für CI-C6-Alkyl oder CI-C6-Halogenalkyl steht.

EMI22.1

steht, worin die Verknüpfungsstelle mit dem TriazolopyrimidinGerüst ist und L1 Fluor, Chlor, CH₃ oder CF₃; L2, L4 unabhängig voneinander Wasserstoff, Methyl oder Fluor; L3 Wasserstoff, Fluor, Chlor, Cyano, CH₃, SCH₃, SOCH₃, SO₂CH₃, OCH₃ NH-C(=O) CH₃, N (CH₃)-C(=O) CH₃ oder COOCH₃; und L5 Wasserstoff, Fluor oder CH₃ bedeuten.

Insbesondere sind im Hinblick auf ihre Verwendung die in den folgenden Tabellen zusammengestellten Verbindungen 1 bevorzugt. Die in den Tabellen für einen Substituenten genannten Gruppen stellen ausserdem für sich betrachtet, unabhängig von der Kombination, in der sie genannt sind, eine besonders bevorzugte Ausgestaltung des betreffenden Substituenten dar.

EMI22.2

Tabelle 1 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln2-Fluor-6-chlor, R3 SH bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 2 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,6-Difluor, R3 SH bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 3 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2, 6-Dichlor, R3 SH bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 4 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Fluor-6-methyl,

Tabelle 5 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,4, 6-Trifluor, R3 SH bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 6 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,6-Difluor-4-SH, R3 SH bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 7 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln Pentafluor, R3 SH bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 8 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln2-Methyl-4-fluor, R3 SH bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 9 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Trifluormethyl, R3 SH bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile, der Tabelle A entspricht Tabelle 10.

Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-SH-6-fluor, R3 SH bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 11 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Chlor, R3 SH bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 12 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Fluor, R3 SH bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 13 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,4-Difluor, R3 SH bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 14 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln2-Fluor-4-chlor,

bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 15 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Chlor-4-fluor, R3 SH bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 16 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,3-Difluor, R3 SH bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 17 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,5-Difluor, R3 SH bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 18 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2, 3, 4-Trifluor, R3 SH bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 19.

Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Methyl, R3 SH bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 20 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,4-Dimethyl, R3 SH bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 21 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Methyl-4-chlor, R3 SH bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 22 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Fluor-4-methyl, R3 SH bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 23 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,6-Dimethyl, R3 SH bedeuten

<Desc/Cims Page number 25>

ten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 24 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2, 4,6-Trimethyl, R3 SH bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile

der Tabelle A entspricht Tabelle 25 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,6-Difluor-4-cyano, R3 SH bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 26 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,6-Difluor-4-methyl, R3 SH bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 27 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,6-Difluor-4-methoxycarbonyl, R3 SH bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 28 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Trifluormethyl-4-fluor, R3 SH bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 29 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Trifluormethyl-5-fluor, R3 SH bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 30 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Trifluormethyl-5-chlor, R3 SH und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 31 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Fluor-6-chlor, R3 Methylthio bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 32 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,6-Difluor,

bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 33 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,6-Dichlor, R3 Methylthio bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 34 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Fluor-6-methyl, R3 Methylthio bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 35 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,4,6-Trifluor, R3 Methylthio bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 36 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,6-Difluor-4-SH, R3 Methylthio bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 37 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln Pentafluor, R3 Methylthio bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 38 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Methyl-4-fluor, R3 Methylthio bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 39 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Trifluormethyl, R3 Methylthio bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 40 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Methylthio-6-fluor, R3 Methylthio bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 41 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Chlor, R3 Methylthio be-

<Desc/Cims Page number 27>

deuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 42 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Fluor, R3 Methylthio bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 43 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,4-Difluor, R3 Methylthio bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 44 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Fluor-4-chlor, R3 Methylthio bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 45 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Chlor-4-fluor, R3 Methylthio bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 46 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,3-Difluor,

thio bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 51 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Methyl-4-chlor, R3 Methylthio bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 52.

Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Fluor-4-methyl, R3 Methylthio bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 53.

Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,6-Dimethyl, R3 Methylthio bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 54 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,4,6-Trimethyl, R3 Methylthio bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 55 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,6-Difluor-4-cyano, R3 Methylthio bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 56 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,6-Difluor-4-methyl, R3 Methylthio bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 57 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,6-Difluor-4-methoxycarbonyl, R3 Methylthio bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 58 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Trifluormethyl-4-fluor, R3 Methylthio bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 59 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Trifluormethyl-5-fluor,

<Desc/Cims Page number 29>

R3 Methylthio bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 60 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln für 2-Trifluormethyl-5-chlor, R3 Methylthio und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 61 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Fluor-6-chlor, R3 Me-thiylsulfinyl ($\text{CH}_3\text{-S(=O)-}$) bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 62 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,6-Difluor, R3 Methylsulfinyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 63 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,6-Dichlor, R3 Methylsulfinyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 64 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Fluor-6-methyl, R3 Me-thiylsulfinyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 65 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,4,6-Trifluor, R3 Methylsulfinyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 66 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,6-Difluor-4-SH, R3 Me-thiylsulfinyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 67 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln Pentafluor, R3 Methylsulfinyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 68 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Methyl-4-fluor, R3 Me-

<Desc/Cims Page number 30>

thiylsulfinyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 69 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Trifluormethyl, R3 Me-thiylsulfinyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 70 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Methylsulfinyl-6-fluor, R3 Methylsulfinyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 71 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Chlor, R3 Methylsulfinyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 72 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Fluor, R3 Methylsulfinyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 73 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,4-Difluor, R3 Methylsulfinyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 74 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Fluor-4-chlor, R3 Me-thiylsulfinyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 75 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Chlor-4-fluor, R3 Me-thiylsulfinyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 76 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,3-Difluor, R3 Methylsulfinyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 77 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,5-Difluor, R3 Methylsul-

<Desc/Cims Page number 31>

finyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 78.

Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,3,4-Trifluor, R3 Methylsulfinyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 79 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Methyl, R3 Methylsulfinyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 80 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,4-Dimethyl, R3 Methylsulfinyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 81 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Methyl-4-chlor, R3 Me-thiylsulfinyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 82 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Fluor-4-methyl, R3 Me-thiylsulfinyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 83 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,6-Dimethyl, R3 Methylsulfinyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 84 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,4,6-Trimethyl, R3 Me-thiylsulfinyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 85 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,6-Difluor-4-cyano, R3 Methylsulfinyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 86 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,6-Difluor-4-methyl, R3

<Desc/Cims Page number 32>

Methylsulfinyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der. Tabelle A entspricht Tabelle 87 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2, 6-Difluor-4-methoxycarbonyl, R3 Methylsulfinyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 88 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Trifluormethyl-4-fluor, R3 Methylsulfinyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 89 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Trifluormethyl-5-fluor, R3 Methylsulfinyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 90.

Verbindungen der Formel IA, in denen Ln für : 2-Trifluormethyl-5-chlor, R3 Methylsulfinyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 91 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Fluor-6-chlor, R3 Methylsulfonyl ($\text{CH}_3\text{-S(=O)-}$) bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 92 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,6-Difluor, R3 Methylsulfonyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 93 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,6-Dichlor, R3 Methylsulfonyl bedeuten und

sulfonyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 96 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,6-Difluor-4-SH, R3 Methylsulfonyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 97 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln Pentafluor, R3 Methylsulfonyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 98 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Methyl-4-fluor, R3 Methylsulfonyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht. Tabelle 99 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Trifluormethyl, R3 Methylsulfonyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle

methylsulfonyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 105 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Chlor-4-fluor, R3 Methylsulfonyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 106 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2, 3-Difluor, R3 Methylsulfonyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 107 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2, 5-Difluor, R3 Methylsulfonyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 108 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,3, 4-Trifluor, R3 Methylsulfonyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 109 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Methyl, R3 Methylsulfonyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 110 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2, 4-Dimethyl, R3 Methylsulfonyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 111 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Methyl-4-chlor, R3 Methylsulfonyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle

sulfonyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 114 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,4, 6-Trimethyl, R3 Methylsulfonyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 115 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,6-Difluor-4-cyano, R3 Methylsulfonyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 116 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,6-Difluor-4-methyl, R3 Methylsulfonyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 117, Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2, 6-Difluor-4-methoxycarbonyl, R3 Methylsulfonyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 118 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Trifluormethyl-4-fluor, R3 Methylsulfonyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 119 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Trifluormethyl-5-fluor,

methyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 123 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,6-Dichlor, R3 Trifluormethyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 124 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Fluor-6-methyl, R3 Trifluormethyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 125 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,4, 6-Trifluor, R3 Triflu-

ormethyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 126 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,6-Difluor-4-SH, R3 Tri- fluormethyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 127 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln Pentafluor, R3 Trifluorme- thyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 128 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Methyl-4-fluor, R3 Tri- fluormethyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 129 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Trifluormethyl, R3 Tri- fluormethyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 130 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Methylthio-6-fluor, R3 Trifluormethyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 131 Verbindungen der Formel IA, in denen

bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Ta- belle A entspricht.

Tabelle 132 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Fluor, R3 Trifluormethyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Ta- belle A entspricht Tabelle 133 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,4-Difluor, R3 Trifluor- methyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 134 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Fluor-4-chlor, R3 Tri- fluormethyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 135 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Chlor-4-fluor, R3 Tri- fluormethyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 136 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2, 3-Difluor, R3 Trifluor- methyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 137 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,5-Difluor, R3 Trifluor- methyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 138 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,3, 4-Trifluor, R3 Triflu- ormethyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 139 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Methyl, R3 Trifluorme- thyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 140 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,4-Dimethyl, R3 Trifluor-

<Desc/Cims Page number 38>

methyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 141 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Methyl-4-chlor, R3 Tri- fluormethyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 142 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Fluor-4-methyl, R3 Tri- fluormethyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 143 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,6-Dimethyl, R3 Trifluor- methyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 144 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,4, 6-Trimethyl, R3. Tri- fluormethyl. bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 145 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2, 6-Difluor-4-cyano, R3 Trifluormethyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 146.

Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2,6-Difluor-4-methyl, R3 Trifluormethyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 147 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2, 6-Difluor-4-methoxycar- bonyl, R3 Trifluormethyl bedeuten und R1 für eine Verbindung je- weils einer Zeile der Tabelle A. entspricht Tabelle 148 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2- Trifluormethyl-4-fluor, R3 Trifluormethyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils ei- ner Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 149 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln 2-Trifluormethyl-5-fluor,

<Desc/Cims Page number 39>

R3 Trifluormethyl bedeuten und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle 150 Verbindungen der Formel IA, in denen Ln für 2-Trifluormethyl-5chlor, R3 Trifluormethyl und R1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht Tabelle A EMI39.1

<tb>

<tb>

<tb> <SEP> Nr. <SEP> R

<tb>

<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-1 <SEP> CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-2 <SEP> CH2CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-3 <SEP> CH2CH2CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-4 <SEP> CH <SEP> (CH3) <SEP> 2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-5 <SEP> CH2CH <SEP> (CH3) <SEP> 2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-6 <SEP> () <SEP> CH <SEP> (CH3) <SEP> CH2CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-7 <SEP> (R) <SEP> CH <SEP> (CH3) <SEP> CH2CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-8 <SEP> (S) <SEP> CH <SEP> (CH3) <SEP> CH2CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-9 <SEP> (CH2) <SEP> 3CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-10 <SEP> C <SEP> (CH3) <SEP> 3
<tb>

<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-11 <SEP> (CH₂)₄CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-12 <SEP> CH <SEP> (CH₂CH₃) <SEP> 2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-13 <SEP> CH₂CH₂CH <SEP> (CH₃) <SEP> 2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-14 <SEP> () <SEP> CH <SEP> (CH₃) <SEP> (CH₂) <SEP> 2CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-15 <SEP> (R) <SEP> CH <SEP> (CH₃) <SEP> (CH₂) <SEP> 2CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-16 <SEP> (S). <SEP> CH <SEP> (CH₃) <SEP> (CH₂) <SEP> 2CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-17 <SEP> (~) <SEP> CH₂CH <SEP> (CH₃) <SEP> CH₂CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-18 <SEP> (R) <SEP> CH₂CH <SEP> (CH₃) <SEP> CH₂CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-19 <SEP> (S) <SEP> CH₂CH <SEP> (CH₃) <SEP> CH₂CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-20 <SEP> () <SEP> CH <SEP> (CH₃) <SEP> CH <SEP> (CH₃) <SEP> 2
<tb>
<tb>

<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-21 <SEP> (R) <SEP> CH <SEP> (CH3) <SEP> CH <SEP> (CH3) <SEP> 2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-22 <SEP> (S) <SEP> CH <SEP> (CH3) <SEP> CH <SEP> (CH3) <SEP> 2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-2 <SEP> 3 <SEP> (CH2) <SEP> 5CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-24 <SEP> (~,~) <SEP> CH <SEP> (CH3) <SEP> CH <SEP> (CH3) <SEP> CH2CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP>) <SEP> CH(CH3) <SEP> CH <SEP> (CH3)CH2CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-26 <SEP> (~, <SEP> S) <SEP> CH <SEP> (CH3) <SEP> CH <SEP> (CH3) <SEP>
CH2CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-27 <SEP> (~) <SEP> CH2CH <SEP> (CH3) <SEP> CF3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-28 <SEP> (R) <SEP> CH2CH <SEP> (CH3) <SEP> CF3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-29 <SEP> (S) <SEP> CH2CH <SEP> (CH3) <SEP> CF3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-30 <SEP> (~) <SEP> CH2CH <SEP> (CF3) <SEP> CH2CH3
<tb>
<tb>

<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-31 <SEP> (R) <SEP> CH₂CH <SEP> (CF₃) <SEP> CH₂CH₃
<tb>

<Desc/Cls Page number 40>

EMI40.1

<tb>
<tb> <SEP> Nr. <SEP> Ri
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-32 <SEP> (S) <SEP> CH₂CH <SEP> (CF₃) <SEP> CH₂CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-33 <SEP> (~,~) <SEP> CH(CH₃) <SEP> CH <SEP> (CH₃) <SEP> CF₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-34 <SEP> (~, <SEP> R) <SEP> CH <SEP> (CH₃) <SEP> CH <SEP> (CH₃) <SEP> CF₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-35 <SEP> (~,S) <SEP> CH <SEP> (CH₃) <SEP> CH <SEP> (CH₃) <SEP> CF₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-36 <SEP> (, <SEP>) <SEP> CH <SEP> (CH₃) <SEP> CH <SEP> (CF₃) <SEP> CH₂CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-37 <SEP> (, <SEP> R) <SEP> CH <SEP> (CH₃) <SEP> CH <SEP> (CF₃) <SEP>
CH₂CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-38 <SEP> (, <SEP> S) <SEP> CH <SEP> (CH₃) <SEP> CH <SEP> (CF₃) <SEP>
CH₂CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-39 <SEP> CF₃.
<tb>
<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<SEP> A-40 <SEP> CF₂CF₃

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<tb> <SEP> A-41 <SEP> CF₂CF₂CF₃

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<tb> <SEP> A-42 <SEP> c-C₃H₅

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<tb> <SEP> A-43 <SEP> (1-CH₃)-c-C₃H₄

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<tb> <SEP> A-44 <SEP> c-C₅H₉

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<tb> <SEP> A-45 <SEP> c-C₆H₁₁

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<tb> <SEP> A-46 <SEP> (4-CH₃)-c-C₆H₁₀

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<tb> <SEP> A-47 <SEP> CH₂C <SEP> (CH₃) <SEP> =CH₂

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<tb> <SEP> A-48 <SEP> CH₂CH₂C <SEP> (CH₃) <SEP> =CH₂

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<tb> <SEP> A-49 <SEP> CH₂-C <SEP> (CH₃) <SEP> 3

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<tb> <SEP> A-50 <SEP> CH₂-Si <SEP> (CH₃) <SEP> 3

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<tb> A-51 <SEP> n-C6H13
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-52 <SEP> (CH2) <SEP> 3-CH <SEP> (CH3) <SEP> 2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-53 <SEP> (CH2) <SEP> 2-CH <SEP> (CH3)-C2H5
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-54 <SEP> CH2-CH <SEP> (CH3)-n-C3H7
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-55 <SEP> CH(CH3)-n-C4H9
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-56 <SEP> CH2-CH <SEP> (C2H5)2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-57 <SEP> CH(C2H5)-n-C3H7
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-58 <SEP> CH2-c-C5H9
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-59 <SEP> CH2-CH <SEP> (CH3) <SEP> -CH <SEP> (CH3) <SEP> 2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-60 <SEP> CH(CH3)-CH2CH <SEP> (CH3) <SEP> 2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-61 <SEP> CH <SEP> (CH3)-CH <SEP> (CH3)-C2H5
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-62 <SEP> CH <SEP> (CH3) <SEP> -C <SEP> (CH3) <SEP> 3
<tb>
<tb>
<tb>

<tb>
<tb> <SEP> A-63 <SEP> (CH2) <SEP> 2-C <SEP> (CH3) <SEP> 3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-64 <SEP> CH2-C <SEP> (CH3) <SEP> 2-C2H5
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-65 <SEP> 2-CH3-c-CSHa
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-66 <SEP> 3-CH3-c-C5H8
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-67 <SEP> C <SEP> (CH3) <SEP> 2-n-C3H7
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-68 <SEP> (CH2) <SEP> 6-CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-69 <SEP> (CH2) <SEP> 4-CH <SEP> (CH3) <SEP> 2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-70 <SEP> (CH2) <SEP> 3-CH <SEP> (CH3)-C2H5
<tb>

<Desc/Cllms Page number 41>

EMI41.1

<tb>
<tb>
<tb> Nr. <SEP> R1
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-71 <SEP> (CH2) <SEP> 2-CH <SEP> (CH3)-n-C3H7
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-72 <SEP> CH2-CH <SEP> (CH3)-n-C4H9

<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-73 <SEP> CH(CH₃)-n-C₅H₁₁
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-74 <SEP> (CH₂) <SEP> 3C <SEP> (CH₃) <SEP> 3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-75 <SEP> (CH₂)₂CH(CH₃)-CH <SEP> (CH₃) <SEP> 2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-76 <SEP> (CH₂) <SEP> CH <SEP> (CH₃) <SEP> -CH₂CH <SEP> (CH₃) <SEP> 2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-77 <SEP> CH <SEP> (CH₃) <SEP> (CH₂) <SEP> 2-CH <SEP> (CH₃) <SEP> 2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-78 <SEP> (CH₂) <SEP> 2C <SEP> (CH₃) <SEP> 2C₂H₅
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-79 <SEP> CH₂CH <SEP> (CH₃) <SEP> CH <SEP> (CH₃) <SEP> C₂H₅
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-80 <SEP> CH <SEP> (CH₃) <SEP> CH₂CH <SEP> (CH₃) <SEP> C₂H₅
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-81 <SEP> CH₂C <SEP> (CH₃) <SEP> 2-n-C₃H₇
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-82 <SEP> CH <SEP> (CH₃) <SEP> CH <SEP> (CH₃)-n-C₃H₇

<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-83 <SEP> C <SEP> (CH3) <SEP> 2-n-C4H9
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-84 <SEP> (CH2) <SEP> 2CH <SEP> (C2H5) <SEP> 2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-85 <SEP> CH2CH(C2H5)-n-C3H7
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-86 <SEP> CH <SEP> (C2H5)-n-C4H9
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-87 <SEP> CH2CH <SEP> (CH3) <SEP> C <SEP> (CH3) <SEP> 3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-88 <SEP> CH. <SEP> (CH3) <SEP> CH2C <SEP> (CH3) <SEP> 3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-89 <SEP> CH2C <SEP> (CH3) <SEP> 2CH <SEP> (CH3) <SEP> 2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-90 <SEP> CH2CH <SEP> (C2H5) <SEP> CH <SEP> (CH3) <SEP> 2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-91 <SEP> CH(CH3) <SEP> CH <SEP> (CH3) <SEP> CH <SEP> (CH3) <SEP> 2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-92 <SEP> C <SEP> (CH3) <SEP> 2CH2CH <SEP> (CH3) <SEP> 2
<tb>

<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-93 <SEP> CH <SEP> (C2H5) <SEP> CH2CH <SEP> (CH3) <SEP> 2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-94 <SEP> CH <SEP> (CH3) <SEP> C <SEP> (CH3) <SEP> 2C2H5
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-95 <SEP> CH(CH3) <SEP> CH <SEP> (C2H5) <SEP> 2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-96 <SEP> C <SEP> (CH3) <SEP> 2CH <SEP> (CH3) <SEP> C2H5
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-97 <SEP> CH(C2H5)CH <SEP> (CH3) <SEP> C2H5
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-98 <SEP> C <SEP> (CH3) <SEP> (C2H5)-n-C3H7
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-99 <SEP> CH(n-C3H7)2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-100 <SEP> CH(n-C3H7) <SEP> CH <SEP> (CH3) <SEP> 2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-101 <SEP> C <SEP> (CH3) <SEP> 2C <SEP> (CH3) <SEP> 3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-102 <SEP> C <SEP> (CH3) <SEP> (C2H5) <SEP> -CH <SEP> (CH3) <SEP> 2
<tb>

<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-103 <SEP> C(C2H5)3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-104 <SEP> (3-CH3)-c-C6H10
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-105 <SEP> (2-CH3)-c-C6H10
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-106 <SEP> n-C8H17
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A107 <SEP> CH2C <SEP> (=NO-CH3) <SEP> CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-108 <SEP> CH2C <SEP> (=NO-C2H5) <SEP> CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-109 <SEP> CH2C <SEP> (=NO-n-C3H7) <SEP> CH3
<tb>

<Desc/Cims Page number 42>

EMI42.1

<tb>
<tb>
<tb> <SEP> Nr. <SEP> Ri
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-110 <SEP> CH2C <SEP> (=NO-i-C3H7) <SEP> CH3
<tb>

<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-111 <SEP> CH <SEP> (CH3) <SEP> C <SEP> (=NOCH3) <SEP> CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-112 <SEP> CH <SEP> (CH3) <SEP> C <SEP> (=NOC2H5) <SEP> CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-113 <SEP> CH <SEP> (CH3) <SEP> C <SEP> (=NO-n-C3H7) <SEP> CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-114 <SEP> CH <SEP> (CH3) <SEP> C <SEP> (=NO-i-C3H7) <SEP> CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-115 <SEP> C <SEP> (=NOCH3) <SEP> C <SEP> (=NOCH3) <SEP> CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-116 <SEP> C <SEP> (=NOCH3) <SEP> C <SEP> (=NOC2H5) <SEP> CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-117 <SEP> C <SEP> (=NOCH3) <SEP> C <SEP> (=NO-n-C3H7) <SEP> CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-118 <SEP> C <SEP> (=NOCH3) <SEP> C <SEP> (=NO-i-C3H7) <SEP> CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>

<tb>
<tb>
<tb> A-119 <SEP> C <SEP> (=NOC2H5) <SEP> C <SEP> (=NOCH3) <SEP> CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-12 <SEP> 0 <SEP> C <SEP> (=NOC2H5) <SEP> C <SEP> (=NOC2H5) <SEP> CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-121 <SEP> C <SEP> (=NOC2H5) <SEP> C <SEP> (=NO-n-C3H7) <SEP> CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-122 <SEP> C <SEP> (=NOC2H5) <SEP> C <SEP> (=NO-i-C3H7) <SEP> CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-123 <SEP> CH2C <SEP> (=NO-CH3) <SEP> C2H5
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-124 <SEP> CH2C <SEP> (=NO-C2H5) <SEP> C2H5
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> . <SEP> A-125 <SEP> CH2C <SEP> (=NO-n-C3H7) <SEP> C2H5
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-126 <SEP> CH2C(=NO-i-C3H7)C2H5
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-127 <SEP> CH <SEP> (CH3) <SEP> C <SEP> (=NOCH3) <SEP> C2H5

<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-128 <SEP> CH <SEP> (CH3) <SEP> C <SEP> (=NOC2H5) <SEP> C2H5
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-12 <SEP> 9 <SEP> CH <SEP> (CH3) <SEP> C <SEP> (=NO-n-C3H7) <SEP> C2H5
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-130 <SEP> CH <SEP> (CH3) <SEP> C <SEP> (=NO-n-C3H7) <SEP> C2H5
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-131 <SEP> C <SEP> (=NOCH3) <SEP> C <SEP> (=NOCH3) <SEP> C2H5
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-132 <SEP> C <SEP> (=NOCH3) <SEP> C <SEP> (=NOC2H5) <SEP> C2H5
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-133 <SEP> C <SEP> (=NOCH3) <SEP> C <SEP> (=NO-n-N3H7) <SEP> C2H5
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-134 <SEP> C <SEP> (=NOCH3) <SEP> C <SEP> (=NO-i-C3H7) <SEP> C2H5
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-135 <SEP> C <SEP> (=NOC2H5) <SEP> C <SEP> (=NOCH3) <SEP> C2H5
<tb>
<tb>
<tb>

<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-136 <SEP> C <SEP> (=NOC2H5) <SEP> C <SEP> (=NOC2H5) <SEP> C2H5
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-137 <SEP> C <SEP> (=NOC2H5) <SEP> C <SEP> (=NO-n-C3H7) <SEP> C2H5
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-138 <SEP> C <SEP> (=NOC2H5) <SEP> C <SEP> (=NO-i-C3H7) <SEP> C2H5
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-139 <SEP> CH=CH-CH2CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-140 <SEP> CH2-CH=CH-CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-141 <SEP> CH2-CH2-CH=CH2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-142 <SEP> C <SEP> (CH3) <SEP> 2CH2CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-143 <SEP> CH=C <SEP> (CH3) <SEP> 2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>

<tb> <SEP> A-144 <SEP> C <SEP> (=CH₂)-CH₂CH₃
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb> <SEP> A-145 <SEP> C <SEP> (CH₃) <SEP> =CH-CH₃
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb> <SEP> A-146 <SEP> CH <SEP> (CH₃) <SEP> CH=CH₂
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb> <SEP> A-147 <SEP> CH=CH-n-C₃H₇
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb> <SEP> A-148 <SEP> CH₂-CH=CH-C₂H₅
 <tb>

<Desc/Cls Page number 43>

EMI43.1

<tb>
 <tb> <SEP> Nr. <SEP> Ri
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb> <SEP> A-149 <SEP> (CH₂) <SEP> 2-CH=CH-CH₃
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb> <SEP> A-150 <SEP> (CH₂) <SEP> 3-CH=CH₂
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb> <SEP> A-151 <SEP> CH=CH-CH <SEP> (CH₃) <SEP> 2
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb>

<tb>
<tb> <SEP> A-152 <SEP> CH₂-CH=C <SEP> (CH₃) <SEP> 2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-153 <SEP> (CH₂) <SEP> 2-C <SEP> (CH₃) <SEP> =CH₂
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-154 <SEP> CH=C <SEP> (CH₃)-C₂H₅
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-155 <SEP> CH₂-C <SEP> (=CH₂) <SEP> -C₂H₅
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-156 <SEP> CH₂-C <SEP> (CH₃) <SEP> =CH-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-157 <SEP> CH₂-CH <SEP> (CH₃)-CH=CH₂
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-158 <SEP> C <SEP> (=CH₂)-CH₂-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-159 <SEP> C <SEP> (CH₃) <SEP> =CH-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-160 <SEP> CH <SEP> (CH₃)-CH=CH-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-161 <SEP> CH(CH₃)-CH₂-CH=CH₂
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-162 <SEP> C(=CH₂) <SEP> CH <SEP> (CH₃) <SEP> 2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-163 <SEP> C <SEP> (CH₃) <SEP> =C <SEP> (CH₃) <SEP> 2
<tb>
<tb>

<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-164 <SEP> CH(CH₃)-C(=CH₂)-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-165 <SEP> C(CH₃)₂-CH=CH₂
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-166 <SEP> C <SEP> (C₂H₅) <SEP> =CH-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-167 <SEP> CH(C₂H₅)-CH=CH₂
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-168 <SEP> CH=CH-CH₂-CH₂-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-169 <SEP> CH₂-CH=CH-CH₂-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-170 <SEP> CH₂-CH₂-CH=CH-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-171 <SEP> CH₂-CH₂-CH₂-CH=CH-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-172 <SEP> CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-CH=CH₂
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-173 <SEP> CH=CH-CH₂-CH <SEP> (CH₃) <SEP> CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-174 <SEP> CH₂-CH=CH-CH <SEP> (CH₃) <SEP> CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-175 <SEP> CH₂-CH₂-CH=C <SEP> (CH₃) <SEP> CH₃
<tb>

<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-176 <SEP> CH₂-CH₂-CH₂-C <SEP> (CH₃) <SEP> =CH₂
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-177 <SEP> CH=CH-CH <SEP> (CH₃)-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-178 <SEP> CH₂-CH=C(CH₃)-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-179 <SEP> CH₂-CH₂-C <SEP> (=CH₂)-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-180 <SEP> CH₂-CH₂-C <SEP> (CH₃) <SEP> =CH-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-181 <SEP> CH₂-CH₂-CH <SEP> (CH₃)-CH=CH₂
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-182 <SEP> CH=C <SEP> (CH₃)-CH₂-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-183 <SEP> CH₂-C <SEP> (=CH₂)-CH₂-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-184 <SEP> CH₂-C <SEP> (CH₃) <SEP> =CH-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-185 <SEP> CH₂-CH <SEP> (CH₃) <SEP> -CH=CH-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-186 <SEP> CH₂-CH(CH₃)-CH₂-CH=CH₂
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-187 <SEP> C <SEP> (=CH₂)-CH₂-CH₂-CH₂-CH₃

<tb>

<Desc/Cims Page number 44>

EMI44.1

<tb>

<tb> <SEP> Nr. <SEP> RI

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<tb> A-188 <SEP> C <SEP> (CH3) <SEP> =CH-CH2-CH2-CH3

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<tb> A-189 <SEP> CH <SEP> (CH3)-CH=CH-CH2-CH3

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<tb> A-190 <SEP> CH <SEP> (CH3)-CH2-CH=CH-CH3

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<tb> A-191 <SEP> CH(CH3)-CH2-CH2-CH=CH2

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<tb> A-192 <SEP> CH=CH-C <SEP> (CH3) <SEP> 3

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<tb> A-193 <SEP> CH=C <SEP> (CH3) <SEP> -CH <SEP> (CH3)-CH3

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<tb> A-194 <SEP> CH2-C(=CH2)-CH <SEP> (CH3) <SEP> -CH3

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<tb> A-195 <SEP> CH2-C <SEP> (CH3) <SEP> =C <SEP> (CH3)-CH3

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<tb> A-196 <SEP> CH2-CH <SEP> (CH3) <SEP> -C <SEP> (=CH2)-CH3

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>
<tb> A-197 <SEP> C <SEP> (=CH₂)-CH₂-CH <SEP> (CH₃) <SEP> -CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-198 <SEP> C <SEP> (CH₃) <SEP> =CH-CH <SEP> (CH₃)-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-199 <SEP> CH(CH₃)-CH=C <SEP> (CH₃) <SEP> -CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-200 <SEP> CH <SEP> (CH₃)-CH₂-C <SEP> (=CH₂) <SEP> -CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-201 <SEP> CH=C <SEP> (CH₂-CH₃)-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-202 <SEP> CH₂-C(=CH-CH₃)-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-203 <SEP> CH₂-CH <SEP> (CH=CH₂) <SEP> -CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-204 <SEP> C <SEP> (=CH-CH₃)-CH₂-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-205 <SEP> CH <SEP> (CH=CH₂)-CH₂-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-206 <SEP> C <SEP> (CH₂-CH₃) <SEP> =CH-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-207 <SEP> CH <SEP> (CH₂-CH₃)-CH=CH-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-208 <SEP> CH <SEP> (CH₂-CH₃)-CH₂-CH=CH₂
<tb>
<tb>

<tb>
<tb>
<tb> A-209 <SEP> CH₂-C <SEP> (CH₃) <SEP> 2-CH=CH₂
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-210 <SEP> C(=CH₂)-CH(CH₃)-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-211 <SEP> C <SEP> (CH₃) <SEP> =C <SEP> (CH₃)-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-212 <SEP> CH <SEP> (CH₃) <SEP> -C <SEP> (=CH₂)-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-213 <SEP> CH <SEP> (CH₃)-C <SEP> (CH₃) <SEP> =CH-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-214 <SEP> CH <SEP> (CH₃)-CH <SEP> (CH₃)-CH=CH₂
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-215 <SEP> C <SEP> (CH₃) <SEP> 2-CH=CH-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-216 <SEP> C <SEP> (CH₃) <SEP> 2-CH₂-CH=CH₂
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-217 <SEP> C <SEP> (=CH₂) <SEP> -C <SEP> (CH₃) <SEP> 3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-218 <SEP> C <SEP> (=CH-CH₃)-CH <SEP> (CH₃) <SEP> -CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-219 <SEP> CH <SEP> (CH=CH₂)-CH <SEP> (CH₃) <SEP> -CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A=220 <SEP> C <SEP> (CH₂-CH₃)=C(CH₃)-CH₃
<tb>

<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-221 <SEP> CH <SEP> (CH₂-CH₃)-C <SEP> (=CH₂) <SEP> -CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-222 <SEP> C <SEP> (CH₃) <SEP> 2-C <SEP> (=CH₂)-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-223 <SEP> C <SEP> (CH₃) <SEP> (CH=CH₂)-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-224 <SEP> C <SEP> (CH₃) <SEP> (CH₂CH₃)-CH₂-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-225 <SEP> CH <SEP> (CH₂CH₃) <SEP> -CH <SEP> (CH₃)-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-226 <SEP> CH <SEP> (CH₂CH₃)-CH₂-CH <SEP> (CH₃)-CH₃
<tb>

<Desc/Cls Page number 45>

EMI45.1

<tb>
<tb> <SEP> Nr. <SEP> R1
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-227 <SEP> C <SEP> (CH₃) <SEP> 2-C <SEP> (CH₃) <SEP> 3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-228 <SEP> C <SEP> (CH₂-CH₃) <SEP> -C <SEP> (CH₃) <SEP> 3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-229 <SEP> C <SEP> (CH₃) <SEP> (CH₂-CH₃) <SEP> -CH <SEP> (CH₃) <SEP> 2
<tb>
<tb>
<tb>

<tb>
<tb> A-230 <SEP> CH <SEP> (CH <SEP> (CH3) <SEP> 2) <SEP> -CH <SEP> (CH3) <SEP> 2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-231 <SEP> CH=CH-CH2-CH2-CH2-CH2-CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-232 <SEP> CH2-CH=CH-CH2-CH2-CH2-CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-233 <SEP> CH2-CH2-CH=CH-CH2-CH2-CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-234 <SEP> CH2-CH2-CH2-CH=CH-CH2-CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-235 <SEP> CH2-CH2-CH2-CH2-CH=CH-CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-236 <SEP> CH2-CH2-CH2-CH2-CH2-CH=CH2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-237 <SEP> CH=CH-CH2-CH2-CH <SEP> (CH3) <SEP> -CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-238 <SEP> CH2-CH=CH-CH2-CH <SEP> (CH3) <SEP> -CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-239 <SEP> CH2-CH2-CH=CH-CH <SEP> (CH3) <SEP> -CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-240 <SEP> CH2-CH2-CH2-CH=C <SEP> (CH3) <SEP> -CH3
<tb>
<tb>
<tb>

<tb>
<tb>
<tb> A-241 <SEP> CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-C <SEP> (=CH₂) <SEP> -CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-242 <SEP> CH=CH-CH₂-CH <SEP> (CH₃) <SEP> -CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-243 <SEP> CH₂-CH=CH-CH <SEP> (CH₃)-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-244 <SEP> CH₂-CH₂-CH=C <SEP> (CH₃)-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-245 <SEP> CH₂-CH₂-CH₂-C(=CH₂)-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-246 <SEP> CH₂-CH₂-CH₂-C <SEP> (CH₃) <SEP> =CH-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-247 <SEP> CH₂-CH₂-CH₂-CH <SEP> (CH₃) <SEP> -CH=CH₂
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-248 <SEP> CH=CH-CH <SEP> (CH₃)-CH₂-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-249 <SEP> CH₂-CH=C <SEP> (CH₃) <SEP> -CH₂-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-250 <SEP> CH₂-CH₂-C <SEP> (=CH₂)-CH₂-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-251 <SEP> CH₂-CH₂-C <SEP> (CH₃) <SEP> =CH-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>

<tb>
<tb>
<tb> A-252 <SEP> CH₂-CH₂-CH <SEP> (CH₃)-CH=CH-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-253 <SEP> CH₂-CH₂-CH <SEP> (CH₃) <SEP> -CH₂-CH=CH₂
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-254 <SEP> CH=C <SEP> (CH₃)-CH₂-CH₂-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-255 <SEP> CH₂-C(=CH₂)-CH₂-CH₂-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-256 <SEP> CH₂-C <SEP> (CH₃) <SEP> =CH-CH₂-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-257 <SEP> CH₂-CH <SEP> (CH₃)-CH=CH-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-258 <SEP> CH₂-CH <SEP> (CH₃) <SEP> -CH₂-CH=CH-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-259 CH₂-CH <SEP> (CH₃)-CH₂-CH₂-CH=CH₂
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-260 <SEP> C <SEP> (=CH₂)-CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-261 <SEP> C <SEP> (CH₃) <SEP> =CH-CH₂-CH₂-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-262 <SEP> CH(CH₃)-CH=CH-CH₂-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>

<tb>
<tb>
<tb> A-263 <SEP> CH(CH3)-CH2-CH=CH-CH2-CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-264 <SEP> CH(CH3)-CH2-CH2-CH=CH-CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-265 <SEP> CH <SEP> (CH3)-CH2-CH2-CH2-CH=CH2
<tb>

<Desc/Clms Page number 46>

EMI46.1

<tb>
<tb> <SEP> Nr. <SEP> Ri
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-266 <SEP> CH=CH-CH2-C <SEP> (CH3) <SEP> 3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-267 <SEP> CH2-CH=CH-C <SEP> (CH3) <SEP> 3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-268 <SEP> CH=CH-CH <SEP> (CH3) <SEP> -CH <SEP> (CH3) <SEP> 2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-269 <SEP> CH2-CH=C <SEP> (CH3)-CH <SEP> (CH3) <SEP> 2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-270 <SEP> CH2-CH2-C <SEP> (=CH2) <SEP> -CH <SEP> (CH3) <SEP> 2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-271 <SEP> CH2-CH2-C <SEP> (CH3) <SEP> =C <SEP> (CH3) <SEP> 2
<tb>

<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-272 <SEP> CH₂-CH₂-CH <SEP> (CH₃) <SEP> -C <SEP> (=CH₂)-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-273 <SEP> CH=C <SEP> (CH₃)-CH₂-CH <SEP> (CH₃) <SEP> 2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-274 <SEP> CH₂-C <SEP> (=CH₂)-CH₂-CH <SEP> (CH₃) <SEP> 2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-275 <SEP> CH₂-C <SEP> (CH₃) <SEP> =CH-CH <SEP> (CH₃) <SEP> 2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-276 <SEP> CH₂-CH <SEP> (CH₃) <SEP> -CH=C <SEP> (CH₃) <SEP> 2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-277CH₂-CH <SEP> (CH₃) <SEP> -CH₂-C <SEP> (=CH₂)-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-278 <SEP> C <SEP> (=CH₂)-CH₂-CH₂-CH <SEP> (CH₃) <SEP> 2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-279 <SEP> C <SEP> (CH₃) <SEP> =CH-CH₂-CH <SEP> (CH₃) <SEP> 2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-280 <SEP> CH <SEP> (CH₃) <SEP> -CH=CH-CH <SEP> (CH₃) <SEP> 2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-281 <SEP> CH <SEP> (CH₃)-CH₂-CH=C <SEP> (CH₃) <SEP> 2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-282 <SEP> CH(CH₃)-CH₂-CH₂-C <SEP> (=CH₂) <SEP> -CH₃
<tb>

<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-283 <SEP> CH=CH-C <SEP> (CH3) <SEP> 2-CH2-CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-284 <SEP> CH2-CH2-C <SEP> (CH3) <SEP> 2-CH=CH2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-285 <SEP> CH=C <SEP> (CH3) <SEP> -CH <SEP> (CH3)-CH2-CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-286 <SEP> CH2-C <SEP> (=CH2) <SEP> -CH <SEP> (CH3)-CH2-CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-287 <SEP> CH2-C <SEP> (CH3) <SEP> =C <SEP> (CH3)-CH2-CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-288 <SEP> CH2-CH <SEP> (CH3) <SEP> -C <SEP> (=CH2)-CH2-CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-289 <SEP> CH2-CH <SEP> (CH3)-C <SEP> (CH3) <SEP> =CH-CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-290 <SEP> CH2-CH <SEP> (CH3) <SEP> -CH <SEP> (CH3)-CH=CH2
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-291 <SEP> C <SEP> (=CH2)-CH2-CH <SEP> (CH3)-CH2-CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-292 <SEP> C <SEP> (CH3) <SEP> =CH-CH <SEP> (CH3)-CH2-CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-293 <SEP> CH <SEP> (CH3) <SEP> -CH=C <SEP> (CH3)-CH2-CH3
<tb>

<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-294 <SEP> CH <SEP> (CH₃)-CH₂-C <SEP> (=CH₂)-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-295CH <SEP> (CH₃) <SEP> -CH₂-C <SEP> (CH₃) <SEP> =CH-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-296 <SEP> CH(CH₃)-CH₂-CH(CH₃)-CH=CH₂
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-297 <SEP> CH₂-C <SEP> (CH₃) <SEP> 2-CH=CH-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-298 <SEP> CH₂-C <SEP> (CH₃) <SEP> 2-CH₂-CH=CH₂
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-299 <SEP> C <SEP> (=CH₂) <SEP> -CH <SEP> (CH₃)-CH₂-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-300 <SEP> C <SEP> (CH₃) <SEP> =C <SEP> (CH₃)-CH₂-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-301 <SEP> CH <SEP> (CH₃) <SEP> -C <SEP> (=CH₂)-CH₂-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-302 <SEP> CH <SEP> (CH₃)-C <SEP> (CH₃) <SEP> =CH-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-303 <SEP> CH <SEP> (CH₃) <SEP> -CH <SEP> (CH₃)-CH=CH-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-304 <SEP> CH <SEP> (CH₃) <SEP> -CH <SEP> (CH₃)-CH₂-CH=CH₂

<tb>

<Desc/Cims Page number 47>

EMI47.1

<tb>

<tb> <SEP> Nr. <SEP> RI

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<tb> A-305 <SEP> C <SEP> (CH3) <SEP> 2-CH=CH-CH2-CH3

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<tb> A-306 <SEP> C <SEP> (CH3) <SEP> 2-CHz-CH=CH-CH3

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<tb> A-307 <SEP> C <SEP> (CH3) <SEP> 2-CH2-CH2-CH=CH2

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<tb> A-308 <SEP> CH=CH-CH(CH2-CH3)-CH2-CH3

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<tb> A-309 <SEP> CH2-CH=C <SEP> (CH2-CH3)-CH2-CH3

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<tb> A-310 <SEP> CH2-CH2-C(=CH-CH3)-CH2-CH3

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<tb> A-311 <SEP> CH2-CH2-CH <SEP> (CH=CH2)-CH2-CH3

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<tb> A-312 <SEP> CH=C <SEP> (CH2-CH3)-CH2-CH2-CH3

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>

<tb> A-313 <SEP> CH2-C <SEP> (=CH-CH3) <SEP> -CH2-CH2-CH3

<tb>

<tb>

<tb>

<tb>
<tb> A-314 <SEP> CH₂-CH <SEP> (CH=CH₂)-CH₂-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-315 <SEP> CH₂-C <SEP> (CH₂-CH₃) <SEP> =CH-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-316 <SEP> CH₂-CH <SEP> (CH₂-CH₃) <SEP> -CH=CH-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-317 <SEP> CH₂-CH <SEP> (CH₂-CH₃)-CH-CH=CH₂
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-318 <SEP> C(=CH-CH₃)-CH₂-CH₂-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-319 <SEP> CH(CH=CH₂)-CH₂-CH₂-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-320C <SEP> (CH₂-CH₃) <SEP> =CH-CH₂-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-321CH <SEP> (CH₂-CH₃)-CH=CH-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-322CH <SEP> (CH₂-CH₃)-CH₂-CH=CH-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-323 <SEP> CH(CH₂-CH₃)-CH₂-CH₂-CH=CH₂
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-324 <SEP> C <SEP> (=CH-CH₂-CH₃)-CH₂-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-325 <SEP> C <SEP> (CH=CH-CH₃)-CH₂-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>

<tb>
<tb>
<tb> A-326 <SEP> C(CH₂-CH=CH₂)-CH₂-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-327 CH=C <SEP> (CH₃) <SEP> -C <SEP> (CH₃) <SEP> 3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-328 <SEP> CH₂-C <SEP> (=CH₂) <SEP> -C <SEP> (CH₃) <SEP> 3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-329 <SEP> CH₂-C <SEP> (CH₃) <SEP> 2-CH <SEP> (=CH₂)-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-330 <SEP> C <SEP> (=CH₂) <SEP> -CH <SEP> (CH₃) <SEP> -CH <SEP> (CH₃)-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-331 <SEP> C(CH₃)=C(CH₃)-CH(CH₃)-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-332 <SEP> CH(CH₃)-C(=CH₂)-CH(CH₃)-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-333 <SEP> CH <SEP> (CH₃) <SEP> -C <SEP> (CH₃) <SEP> =C <SEP> (CH₃)-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-334 <SEP> CH <SEP> (CH₃) <SEP> -CH <SEP> (CH₃) <SEP> -C <SEP> (=CH₂)-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-335 <SEP> C <SEP> (CH₃) <SEP> 2-CH=C <SEP> (CH₃) <SEP> -CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-336 <SEP> C <SEP> (CH₃) <SEP> 2-CH₂-C <SEP> (=CH₂)-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-337 <SEP> C(CH₃)₂-C(=CH₂)-CH₂-CH₃
<tb>

<tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb> A-338 <SEP> C <SEP> (CH3) <SEP> 2-C <SEP> (CH3) <SEP> =CH-CH3
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb> A-339 <SEP> C <SEP> (CH3) <SEP> 2-CH <SEP> (CH3) <SEP> CH=CH2
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb> A-340 <SEP> CH(CH2-CH3)-CH2-CH <SEP> (CH3) <SEP> -CH3
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb> A-341 <SEP> CH <SEP> (CH2-CH3)-CH <SEP> (CH3) <SEP> -CH2-CH3
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb> A-342 <SEP> C <SEP> (CH3) <SEP> (CH2-CH3)-CH2-CH2-CH3
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb> A-343 <SEP> CH <SEP> (i-C3H7)-CH2-CH2-CH3
 <tb>

<Desc/Cims Page number 48>

EMI48.1

<tb>
 <tb> <SEP> Nr. <SEP> Ri
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb> <SEP> A-344 <SEP> CH=C <SEP> (CH2-CH3) <SEP> -CH <SEP> (CH3)-CH3
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb> <SEP> A-345 <SEP> CH2-C <SEP> (=CH-CH3)-CH <SEP> (CH3)-CH3
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb>
 <tb> <SEP> A-346 <SEP> CH2-CH(CH=CH2)-CH <SEP> (CH3) <SEP> -CH3
 <tb>
 <tb>
 <tb>

<tb>
<tb> <SEP> A-347 <SEP> CH₂-C <SEP> (CH₂-CH₃) <SEP> =C <SEP> (CH₃)-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-348 <SEP> CH₂-CH <SEP> (CH₂-CH₃)-C <SEP> (=CH₂)-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-349 <SEP> CH₂-C <SEP> (CH₃) <SEP> (CH=CH₂)-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-350 <SEP> C <SEP> (=CH₂)-CH <SEP> (CH₂-CH₃)-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-351 <SEP> C <SEP> (CH₃) <SEP> =C <SEP> (CH₂-CH₃)-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-352 <SEP> CH <SEP> (CH₃) <SEP> -C <SEP> (=CH-CH₃)-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-353 <SEP> CH <SEP> (CH₃) <SEP> -CH <SEP> (CH=CH₂)-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-354 <SEP> CH=C <SEP> (CH₂-CH₃) <SEP> -CH <SEP> (CH₃)-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-355 <SEP> CH₂-C(=CH-CH₃)-CH <SEP> (CH₃) <SEP> -CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-356 <SEP> CH₂-CH <SEP> (CH=CH₂) <SEP> -CH <SEP> (CH₃)-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-357 <SEP> CH₂-C(CH₂-CH₃)=C(CH₃)-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>

<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-358 <SEP> CH₂-CH(CH₂-CH₃)-C(=CH₂)-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-359. <SEP> C <SEP> (=CH-CH₃)-CH₂-CH <SEP> (CH₃)-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-3 <SEP> 60CH <SEP> (CH=CH₂)-CH₂-CH <SEP> (CH₃)-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-3 <SEP> 61'C <SEP> (CH₂-CH₃) <SEP> =CH-CH <SEP> (CH₃)-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-3 <SEP> 62 <SEP> CH <SEP> (CH₂-CH₃) <SEP> CH=C <SEP> (CH₃)-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-363 <SEP> CH(CH₂-CH₃)CH₂-C(=CH₂)-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-364 <SEP> C(=CH-CH₃)CH(CH₃)-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-365 <SEP> CH <SEP> (CH=CH₂) <SEP> CH <SEP> (CH₃)-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-366 <SEP> C(CH₂-CH₃) <SEP> =C <SEP> (CH₃)-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-367 <SEP> CH <SEP> (CH₂-CH₃)-C <SEP> (=CH₂)-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-368 <SEP> CH <SEP> (CH₂-CH₃)-C <SEP> (CH₃) <SEP> =CH-CH₃
<tb>
<tb>

<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-369 <SEP> CH <SEP> (CH₂-CH₃)-CH <SEP> (CH₃)-CH=CH₂
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-370 <SEP> C <SEP> (CH₃) <SEP> (CH=CH₂)-CH₂-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-371 <SEP> C <SEP> (CH₃) <SEP> (CH₂-CH₃)-CH=CH-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-372 <SEP> C <SEP> (CH₃) <SEP> (CH₂-CH₃)-CH₂-CH=CH₂
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-373 <SEP> C[=C(CH₃)-CH₃]-CH₂-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-374 <SEP> CH <SEP> [C <SEP> (=CH₂)-CH₃]-CH₂-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-375 <SEP> C(I-C₃H₇) <SEP> =CH-CH₂-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-376 <SEP> CH(I-C₃H₇)-CH=CH-CH₃
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-377 <SEP> CH <SEP> (i-C₃H₇)-CH₂-CH=CH₂
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-378 <SEP> C(=CH-CH₃)-C <SEP> (CH₃) <SEP> 3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-379 <SEP> CH <SEP> (CH=CH₂) <SEP> -C <SEP> (CH₃) <SEP> 3
<tb>
<tb>

<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-380 <SEP> C <SEP> (CH3) <SEP> (CH=CH2) <SEP> CH <SEP> (CH3)-CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-381 <SEP> C <SEP> (CH3) <SEP> (CH2-CH3) <SEP> C <SEP> (=CH2)-CH3
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> <SEP> A-382 <SEP> 2-CH3-Cyclohex-1-enyl
<tb>

<Desc/Cls Page number 49>

EMI49.1

<tb>
<tb> Nr. <SEP> R1
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-383 <SEP> [2-(=CH2)]-c-C6Hs
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-384 <SEP> 2-CH3-Cyclohex-2-enyl
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-385 <SEP> 2-CH3-Cyclohex-3-enyl
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-386 <SEP> 2-CH3-Cyclohex-4-enyl
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-387 <SEP> 2-CH3-Cyclohex-5-enyl
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-388 <SEP> 2-CH3-Cyclohex-6-enyl
<tb>

<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-389 <SEP> 3-CH3-Cyclohex-1-enyl
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-390 <SEP> 3-CH3-Cyclohex-2-enyl
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-391 <SEP> [3-(=CH2)]-c-C6H9
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-392 <SEP> 3-CH3-Cyclohex-3-enyl
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-393 <SEP> 3-CH3-Cyclohex-4-enyl
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-394 <SEP> 3-CH3-Cyclohex-5-enyl
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-395 <SEP> 3-CH3-Cyclohex-6-enyl
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-396 <SEP> 4-CH3-Cyclohex-1-enyl
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-397 <SEP> 4-CH3-Cyclohex-2-enyl
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-398 <SEP> 4-CH3-Cyclohex-3-enyl
<tb>
<tb>
<tb>
<tb>
<tb> A-399 <SEP> [4- <SEP> (=CH2)]-c-C6H9
<tb>

Die Verbindungen I eignen sich als Fungizide. Sie zeichnen sich aus durch eine hervorragende

Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen, insbesondere aus der Klasse der Ascomyceten, Deuteromyceten, Oomyceten und Basidiomyceten. Sie sind zum Teil systemisch wirksam und können im Pflanzenschutz als Blatt- und Bodenfungizide eingesetzt werden.

Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung einer Vielzahl von Pilzen an verschiedenen Kulturpflanzen wie Weizen, Roggen, Gerste, Hafer, Reis, Mais, Gras, Bananen, Baumwolle, Soja, Kaffee, Zuckerrohr, Wein, Obst- und Zierpflanzen und Gemüsepflanzen wie Gurken, Bohnen, Tomaten, Kartoffeln und Krbisgewächsen, sowie an den Samen dieser Pflanzen.

Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten: -*Alternaria*-Arten an Gemüse und Obst, *Bipolaris*- und *Drechslera*-Arten an Getreide, Reis und Rasen, *Blumeria graminis* (echter Mehltau) an Getreide, *Botrytis cinerea* (Grauschimmel) an Erdbeeren, Gemüse, Zierpflanzen und Reben, *Erysiphe cichoracearum* und *Sphaerotheca fuliginea* an Krbisgewächsen, *Fusarium*- und *Verticillium*-Arten an verschiedenen Pflanzen,

<Desc/Cims Page number 50>

Mycosphaerella-Arten an Getreide, Bananen und Erdnüssen, *Phytophthora infestans* an Kartoffeln und Tomaten, *Plasmopara viticola* an Reben, *Podosphaera leucotricha* an Äpfeln, *Pseudocercospora herpotrichoides* an Weizen und Gerste, *Pseudoperonospora*-Arten an Hopfen und Gurken, *Puccinia*-Arten an Getreide, *Pyricularia oryzae* an Reis, *Rhizoctonia*-Arten an Baumwolle, Reis und Rasen, *Septoria tritici* und *Stagonospora nodorum* an Weizen, *Uncinula necator* an Reben, *Ustilago*-Arten an Getreide und Zuckerrohr, sowie *Venturia*-Arten (Schorf) an Äpfeln und Birnen.

Die Verbindungen I eignen sich außerdem zur Bekämpfung von Schadpilzen wie *Paecilomyces variotii* im Materialschutz (z. B. Holz, Papier, Dispersionen für den Anstrich, Fasern bzw. Gewebe) und im Vorratsschutz.

Die Verbindungen I werden angewendet, indem man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Pflanzen, Saatgut, Materialien oder den Erdboden mit einer fungizid wirksamen Menge der Wirkstoffe behandelt. Die Anwendung kann sowohl vor als auch nach der Infektion der Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze erfolgen.

Die fungiziden Mittel enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 Gew.-% Wirkstoff.

Die Aufwandmengen liegen bei der Anwendung im Pflanzenschutz je nach Art des gewünschten Effektes zwischen 0,01 und 2,0 kg Wirkstoff pro ha.

Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 0,001 bis 0,1 g, vorzugsweise 0,01 bis 0,05 g je Kilogramm Saatgut benötigt.

Bei der Anwendung im Material- bzw. Vorratsschutz richtet sich die Aufwandmenge an Wirkstoff nach der Art des Einsatzgebietes und des gewünschten Effektes. Mögliche Aufwandmengen sind im Materialschutz beispielsweise 0,001 g bis 2 kg, vorzugsweise 0,005 g bis 1 kg Wirkstoff pro Kubikmeter behandelten Materials.

Die Verbindungen I können in die üblichen Formulierungen überführt werden, z. B. Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Stäube, Pulver, Pasten und Granulate. Die Anwendungsform richtet sich nach dem jeweiligen Verwendungszweck; sie soll in jedem Fall eine

<Desc/Cims Page number 51>

feine und gleichmäßige Verteilung der erfindungsgemäßen Verbindung gewährleisten.

Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z. B. durch Verstrecken des Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwendung von Emulgiermitteln und Dispergiermitteln. Als Lösungsmittel/Hilfsstoffe kommen dafür im wesentlichen in Betracht: Wasser, aromatische Lösungsmittel (z. B. Solvesso Produkte, Xylol), Paraffine (z. B. Erdfraktionen), Alkohole (z. B. Methanol, Butanol, Pentanol, Benzylalkohol), Ketone (z. B.

Cyclohexanon, gamma-Butyrolacton), Pyrrolidone (NMP, NOP), Acetate (Glykoldiacetat), Glykole, Dimethylfette ureamide, Fettsäuren und Fettsäureester. Grundsätzlich können auch Lösungsmittelgemische verwendet werden, Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z. B. Kaoline, Tonen, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z. B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate); Emulgiermittel wie nichtionogene und anionische Emulgatoren (z. B. Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergiermittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäuren, Naphthalinsulfonsäuren, Phenolsulfonsäuren, Dibutyl-naphthalinsulfonsäuren, Alkylaryl-sulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate, Fettsäuren und sulfatierte Fettalkoholglykolether zum Einsatz, ferner Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäuren mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykolether, Tributylphenylpolyglykolether, Tristerylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole, Alkohol- und Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoletheracetat, Sorbitester, Ligninsulfitablaugen und Methylcellulose in Betracht.

Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Dispersionen kommen Mineralfractionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Diesell, ferner Kohlenteeerle sowie tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z. B.

Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naph-

<Desc/Cims Page number 52>

thaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Isophoron, stark polare Lösungsmittel, z. B. Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon oder Wasser in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z. B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind z. B. Mineralerden, wie Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Attaclay, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Lehm, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie z. B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nusschalenmehl, Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,01 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 90 Gew.-% des Wirkstoffs.

Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

Beispiele für Formulierungen sind: 1. Produkte zur Verdünnung in Wasser A) Wasserlösliche Konzentrate (SL)

10 Gew.-% Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Wasser oder einem wasserlöslichen Lösungsmittel gelöst. Alternativ werden Netzmittel oder andere Hilfsmittel zugefügt.

Bei der Verdünnung in Wasser ist sich der Wirkstoff.

*B) Dispergierbare Konzentrate (DC)

20 Gew.-% Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Cyclohexanon unter Zusatz eines Dispergiermittels z. B. Polyvinylpyrrolidon gelöst. Bei Verdünnung in

Wasser ergibt sich eine Dispersion.

C) Emulgierbare Konzentrate (EC)

15 Gew. -Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Xylol unter Zusatz von Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinus- lethoxylat (jeweils 5%) gelöst. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion.

<Desc/Cims Page number 53>

D) Emulsionen (EW, EO) 40 Gew. -Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Xylol unter Zusatz von Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinus- lethoxylat (jeweils 5%) gelöst. Diese Mischung wird mittels einer Emulgiermaschine (Ultraturax) in Wasser eingebracht und zu einer homogenen Emulsion gebracht. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion.

E) Suspensionen (SC, OD)

20 Gew. -Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln und Wasser oder einem organischen Lösungsmittel in einer Rührwerkskugelmühle zu einer feinen Wirkstoffsuspension zerkleinert. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Suspension des Wirkstoffs.

F) Wasserdispergierbare und wasserlösliche Granulate (WG, SG)

50 Gew. -Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln fein gemahlen und mittels technischer Geräte (z. B. Extrusion, Sprhturm, Wirbelschicht) als Wasserdispergierbare oder wasserlösliche Granulate hergestellt. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs.

G) Wasserdispergierbare und wasserlösliche Pulver (WP, SP)

75 Gew. -Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln sowie Kieselsäure in einer Rotor-Strator Mühle vermahlen. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs.

2. Produkte für die Direktapplikation H) Stäube (DP)

5 Gew. Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95% feinteiligem Kaolin innig vermischt.

Man erhält dadurch ein Stäubemittel.

I) Granulate (GR, FG, GG, MG)

0.5 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95.5% Trägerstoffe verbunden. Geeignete Verfahren sind dabei die Extrusion, die Sprühtrocknung oder die Wirbelschicht. Man erhält dadurch ein Granulat für die Direktapplikation.

<Desc/Cims Page number 54>

J) ULV-Lösungen (UL)

10 Gew. -Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einem organischen Lösungsmittel z. B. Xylol gelöst. Dadurch erhält man ein Produkt für die Direktapplikation.

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z. B. in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die

Anwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken ; sie sollten in je- dem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemässen Wirkstoffe gewährleisten.

Wässrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pa- sten oder netzbaren Pulvern (Spritzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substanzen als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittelsNetz-, Haft-, Dispergier-oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz Netz-, Haft-, Dispergier-oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfertigen Zu- bereitungen können in grösseren Bereichen variiert werden. Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,0001 und 10%, vorzugsweise zwi- schen 0,01 und 1%.

Die Wirkstoffe können auch mit gutem Erfolg im Ultra-Low-Volume- Verfahren (ULV) verwendet werden, wobei es möglich ist, Formulie- rungen mit mehr als 95Gew.-% Wirkstoff oder sogar den Wirkstoff ohne Zusätze auszubringen.

Zu den Wirkstoffen können Öle verschiedenen Typs, Netzmittel, Adjuvants, Herbizide, Fungizide, andere Schädlingsbekämpfungsmi- tel, Bakterizide, gegebenenfalls auch erst unmittelbar vor der Anwendung (Tankmix), zugesetzt werden. Diese Mittel können zu den erfindungsgemässen Mitteln im Gewichtsverhältnis 1 : 10 bis 10 : 1 zu- gemischt werden.

Die erfindungsgemässen Mittel können in der Anwendungsform als Fungizide auch zusammen mit anderen Wirkstoffen vorliegen, der z. B. mit Herbiziden, Insektiziden, Wachstumsregulatoren, Fungizi- den oder auch mit Düngemitteln. Beim Vermischen der Verbindungen

<Desc/Cims Page number 55>

I bzw. der sie enthaltenden Mittel in der Anwendungsform als Fun- gizide mit anderen Fungiziden erhält man in vielen Fällen eine Vergrösserung des fungiziden Wirkungsspektrums.

Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungs- gemässen Verbindungen gemeinsam angewendet werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken :# Acylalamine wie Benalaxyl, Metalaxyl, Ofurace, Oxadixyl,.

Aminderivate wie Aldimorph, Dodine, Dodemorph, Fenpropimorph, Fenpropidin, Guazatine, Iminoctadine, Spiroxamin, Tridemorph # Anilinopyrimidine wie Pyrimethanil, Mepanipyrim oder Cyrodi- nyl, Antibiotika wie Cycloheximid, Griseofulvin, Kasugamycin, Na- tamycin, Polyoxin oder Streptomycin, Azole wie Bitertanol, Bromoconazol, Cyproconazol, Difenconazole, Dinitroconazol, Epoxiconazol, Fenbuconazol, Fluquiconazole, Flusilazol, Hexaconazol, Imazalil, Metconazol, Myclobu- tanil, Penconazol, Propiconazol, Prochloraz, Prothioconazol, Tebuconazol, Triadimefon, Triadimenol, Triflumizol, Tritico- nazol,

Strobilurine wie Azoxystrobin, Dimoxystrobin, Fluoxastrobin, Kresoxim-methyl, Metominostrobin, Orysastrobin, Picoxystro- bin, Pyraclostrobin oder Trifloxystrobin, Sulfensäurederivate wie Captafol, Captan, Dichlofluanid, Fol- pet, Tolyfluanid.

Zimtsäureamide und Analoge wie Dimethomorph, Flumetover oder Flumorph.

Synthesebeispiele Beispiel 1 : Herstellung von 2-Methylthio-5-chlor-6-(2, 4,6-triflu- or-phenyl)-7- (2-methylbutyl)-1, 2,4-triazolo [1, 5a] pyrimidin(I-1)

EMI56.1

1.1. 2-Methylthio-5,7-dihydroxy-6- (2, 4,6-trifluor-phenyl) -1,2, 4-triazolo [1, 5a] pyrimidin.

EMI56.2

Eine Mischung von 45 g (0,171 mol) (2,4,6-Trifluorphenyl)-malon- säuredimethylester, 30 g (0,162 mol) Tributylamin und 20 g (0,108 mol) 3-Amino-5-methylthio-1, 2,4-triazol wurde ca. 6 Stunden bei 160 °C

gerührt, wobei das gebildete Methanol abdestilliert wurde.

Anschliessend wurde die Reaktionsmischung auf 80 °C gekühlt und mit 100 ml 20 % iger Natronlauge versetzt. Die wässrige Phase wurde mit Methyl-t-butylether gewaschen und die organische Phase wurde verworfen. Dann wurde die wässrige Phase mit verdünnter Salzsäure angesäuert und mit Wasser verdünnt, wobei ein heller Festkörper ausfiel. Der Festkörper wurde über Nacht ausgerührt, abgesaugt, mit Wasser und Methyl-t-butylether gewaschen und im Vakuum bei 50 °C getrocknet.

Man erhielt 45 g (92%) der Verbindung 1.1. als beigen Festkörper, der ohne weitere Reinigung in der nächsten Reaktion eingesetzt wurde.

1.2. 2-Methylthio-5,7-dichlor-6- (2, 4,6-trifluor-phenyl) -1,2, 4-triazolo [1, 5a] pyrimidin

<Desc/Cims Page number 57>

EMI57.1

Eine Mischung von 45 g (0,137 mol) 2-Methylthio-5,7-dihydroxy-6- (2,4,6-trifluor-phenyl)-1, 2,4-triazolo [1, 5a] pyrimidin (Beispiel 1.1) in 200 ml Phosphoroxychlorid wurde ca. 8 Stunden zum Rückfluss erhitzt.

Anschliessend wurde überschüssiges Phosphoroxychlorid abdestilliert und der Rückstand wurde mit Methylenchlorid aufgenommen. Man gab die organische Phase auf Wasser gegeben rührte kräftig. Die organische Phase wurde abgetrennt, mit NaHCO₃-Lsg. extrahiert und eingengt. Dann wurde der Rückstand säulenchromatographisch mit Cyclohexan/Essigester-Gemischen gereinigt. Man erhielt 42 g (84 %) der Titelverbindung 1.2. als hellen Festkörper.

¹H-NMR (CDCl₃, in ppm) : 6,9 (t, 2H) ; 2,75 (s, 3H) 1.3.2-Methylthio-5-chlor-6- (2, 4,6-trifluor-phenyl)-7- (2-methyl- butyl) -1,2, 4-triazolo [1, 5a] pyrimidin

EMI57.2

Zu einer Suspension von 4,8 g (0,2 mol) Magnesium und einer katalytischen Menge. Jod in 50 ml Tetrahydrofuran wurde bei ca. 70 °C Badtemperatur eine Lösung von 31g (0,2 mol) 2-Methyl-butylbromid in 50 ml Tetrahydrofuran getropft. Es wurde ca. 30 min bei dieser Temperatur gerührt und anschliessend auf Raumtemperatur gekühlt.

Diese Grignard-Lsg. wurde dann bei 10-20 °C zu einer Mischung von 46 g (0,2 mol) Zinkbromid in 200 ml Tetrahydrofuran gegeben. Nach ca. 30 min kühlte man auf 10 °C und gab eine Mischung von 17,4 g (0,4 mol) Lithiumchlorid und 18 g (0,2 mol) Kupfercyanid in 100 ml Tetrahydrofuran hinzu. Dann wurde die Reaktionsmischung auf 40 °C gekühlt und mit 36 g (0,1 mol) 2-Methylthio-5,7-dichlor-6- (2,4,6-trifluor-phenyl)-1, 2,4-triazolo [1, 5a] pyrimidin (Beispiel 1.2.) in 50 ml Tetrahydrofuran versetzt. Man rührte über Nacht

<Desc/Cims Page number 58>

bei Raumtemperatur, verdünnte die Reaktionsmischung mit Methyl-t-butylether und hydrolysierte mit Ammoniumchlorid-Lsg.

Anschliessend trennte die organische Phase ab und extrahierte die wässrige Phase dreimal mit Methylenchlorid. Die vereinigten organischen Phasen wurden eingengt und der Rückstand wurde zusammen mit einem separat durchgeführten 12,3 mmol Ansatz säulenchromatographisch gereinigt. Man erhielt 39,5 g (88%) der Titelverbindung 1.3. als hellen Festkörper (Fp = 92-94 °C).

¹H-NMR (CDCl₃, in ppm) : 6,9 (t, 2H) ; 3,1 (dd, 1H) ; 2,7 (dd, 1H) ; 2,7 (s, 3H) ; 2,05 (m, 1H) ; 1,25 (m, 1H) ; 1,15 (m, 1H) ; 0,8 (t, 3H) ; 0,75 (d, 3H) Beispiel 2 : 2-Methylthio-5-methyl-6- (2, 4,6-trifluor-phenyl)-7- (2-methylbutyl)-1, 2,4-triazolo [1, 5a] pyrimidin (1-2)

EMI58.1

2.1.2-Methylthio-5- (dimethylmalon-2-yl)-6- (2, 4,6-trifluor-phenyl)-7- (2-methylbutyl)-1, 2,4-triazolo [1, 5a] pyrimidin

EMI58.2

Eine Mischung von 39 g (95 mmol) 2-Methylthio-5-chlor-6- (2, 4,6-trifluor-phenyl)-7- (2-methylbutyl)-1, 2,4-triazolo [1, 5a] pyrimidin (Beispiel 1.3) und 40 g (260 mmol) Natrium-dimethylmalonat wurde ca. 3 Stunden bei 75 °C Badtemperatur gerührt.

Dann wurde die Reaktionsmischung auf Raumtemperatur gekühlt und mit Methyl-t-butylether versetzt, wobei ein gelber Festkörper ausfiel. Dieser gelbe Festkörper wurde mit einer Mischung aus verd. Salzsäure und Methyl-t-butylether gerührt, wobei Entfärbung eintrat. Anschliessend wurde die organische Phase abgetrennt, über Magnesiumsulfat getrocknet und eingeeengt. Der Rückstand kristallisierte und wurde mit Diisopropylether/Hexan ausgereinigt. Man er-

<Desc/Cims Page number 59>

hielt 34 g (72%) der Titelverbindung 2.1. als hellen Festkörper (Fp =126-128 C).

¹H-NMR (CDC13, 8 in ppm) : 6,9 (t, 2H) ; 4,7 (s, 1H) ; 3,75 (s, 3H) ; 3,7 (s, 3H) ; 3,0 (dd, 1H) ; 2,7 (s, 3H) ; 2,7 (dd, 1H) ; 2,05 (m, 1H) ; 1,25 (m, 1H.) ; 1,1 (m, 1H) ; 0,8 (t, 3H) ; 0,7 (d, 3H) 2.2. 2-Methylthio-5-methyl-6- (2, 4, 6-trifluor-phenyl)-7- (2-methyl- butyl) -1,2, 4-triazolo [1, 5a] pyrimidin

EMI59.1

34 g (68 mmol) 2-Methylthio-5- (dimethylmalon-2-yl)-6- (2, 4, 6-tri- fluor-phenyl)-7- (2-methylbutyl) -1, 2, 4-triazolo [1, 5a] pyrimidin (Beispiel 2.1) in 200 ml konz. Salzsäure wurden ca. 4 Stunden auf 90 C erhitzt. Anschliessend verdünnte man die Reaktionsmischung mit Wasser und extrahierte die wässrige Phase mit Methyl-t-butylether. Die vereinigten organischen Phasen wurden mit NaHCO₃-Lsg. und Wasser gewaschen, getrocknet und. eingeeengt. Man erhielt 27 g (Ausbeute quant.) der Titelverbindung 2.2. als viskose Masse, die langsam durchkristallisierte (Fp =67-69 C).

¹H-NMR (CDC13, # in ppm) : 6,9 (t, 2H) ; 3,0 (dd, 1H) ; 2,75 (s, 3H) ; 2,7 (dd, 1H) ; 2,4. (s, 3H) ; 2,05 (m, 1H) ; 1,3 (m, 1H) ; 1,15 (m, 1H) ; 0,8 (t, 3H) ; 0,75 (d, 3H) Beispiel 3 :2-Methylsulfoxyl-5-methyl-6- (2, 4,6-trifluor-phe-nyl)-7- (2-methylbutyl)-1, 2, 4-triazol. o [1, 5a] pyrimidin a(1-4) und 2-Methylsulfonyl-5-methyl-6- (2, 4,6-trifluor-phenyl)-7- (2-methyl-butyl)-1, 2,4-triazolo [1, 5a]pyrimidin b (1-3)

EMI59.2

a b 1,99 g (5 mmol) 2-Methylthio-5-methyl-6- (2, 4,6-trifluor-phe-nyl)-7- (2-methylbutyl)-1, 2,4-triazolo [1, 5a] pyrimidin (Beispiel 2.2) in 20 ml Methylenchlorid wurden mit 1,6 g (7,2 mmol) 77 % iger m-Chlorperbenzoesäure versetzt und ca.1 Stunde bei Raum-

<Desc/Cims Page number 60>

temperatur gerührt. Dann gab man noch 100 mg 77% ige m-Chlorper- benzoesäure hinzu und rührt zusätzlich ca.1 Stunde.

Anschliessend wurde die Reaktionsmischung mit verdünnter. Natron- lauge und Wasser gewaschen und eingeeengt. Der Rückstand wurde säulenchromatographisch mit Cyclohexan/Essigester-Gemischen gereinigt.

Man erhielt in dieser Reihenfolge 0,5 g (24%) des Sulfons b als hellen Festkörper und 1,1 g (56%) des Sulfoxids a als hellgelbes Öl.

Sulfon b : (1-3) ¹H-NMR(CDC13, # in ppm) : 6,9 (t, 2H) ; 3,45(s, 3H) ; 3,05 (dd, 1H) ; 2,8 (dd, 1H) ; 2,5(s, 3H) ; 2,05 (m, 1H) ; 1,25 (m, 1H) ; 1,1(m, 1H) ; 0,8 (t, 3H) ; 0,75 (d, 2H) Sulfoxid a : (1-4) ¹H-NMR (CDC13, 8 in ppm) : 6,95 (t, 2H) ; 3,2 (s, 3H) ; 3,1 (ddd, 1H) ; 2,85 (ddd, 1H) ; 2,5 (s, 3H) ; 2,05 (m, 1H) ; 1,25 (m, 1H) ; 1,15 (m, 1H) ; 0,75 (m, 6H) Beispiel 4 : 2-Cyano-5-methyl-6- (2, 4,6-trifluor-phe- 4,5 <SEP> (S, <SEP> 2H) <SEP> ; <SEP> 2,4 <SEP> (S, <SEP> 3H) <tb> I-6 <SEP> 2-Methylbutyl <SEP> Methyl <SEP> SO₂-Benzyl <SEP> 2,4,6-F3 <SEP> 6,8 <SEP> (t, <SEP> 2H) <SEP> ; <SEP> 4,8 <SEP> (s, <SEP> 2H) <SEP> ; <SEP> 2,5 <SEP> (s, <SEP> 3H) <tb> I-7 <SEP> 2-Methylbutyl <SEP> Methyl <SEP> SO-Benzyl <SEP> 2,4,6-F3 <SEP> 6,9 <SEP> (t, <SEP> 2H) <SEP> ; <SEP> 2,5 <SEP> (s, <SEP> 3H) <SEP> ; <SEP> 0,65 <SEP> (d, <SEP> 3H) <tb> I-8 <SEP> 2-Methylbutyl <SEP> Methyl <SEP> Cyano <SEP> 2,4,6-F3 <SEP> 113-115 <tb> I-9 <SEP> 2-Methylbutyl <SEP> Methyl <SEP> NH-n-C₃H₇ <SEP> 2,4,6-F3 <SEP> 126-130 <tb> I-10 <SEP> 2-Methylbutyl <SEP> Methyl <SEP> S-C₂H₅ <SEP> 2,4,6-F3 <SEP> 6,85 <SEP> (t, <SEP> 2H) <SEP> ; <SEP> 3,3 <SEP> (q, <SEP> 2H) <SEP> ; <SEP> 2,4 <SEP> (s, <SEP> 3H) <tb> I-11 <SEP> 2-Methylbutyl <SEP> Methyl <SEP> Methoxy <SEP> 2,4,6-F3 <SEP> 6,9 <SEP> (t, <SEP> 2H) <SEP> ; <SEP> 4,2 <SEP> (s, <SEP> 3H) <SEP> ; <SEP> 2,4 <SEP> (s, <SEP> 3H) <tb> I-12 <SEP> 2-Methylbutyl <SEP> Methyl <SEP> Ethoxy <SEP> 2,4,6-F3 <SEP> 6,9 <SEP> (t, <SEP> 2H) <SEP> ; <SEP> 4,55 <SEP> (q, <SEP> 2H) <SEP> ; <SEP> 2,4 <SEP> (s, <SEP> 3H) <tb> I-13 <SEP> 2-Methylbutyl <SEP> Methyl <SEP> SO-C₂H₅ <SEP> 2,4,6-F3 <SEP> 6,9 <SEP> (s,

<SEP> 2H0 <SEP> ; <SEP> 3,35-3,5 <SEP> (m, <SEP> 2H) <SEP> ; <SEP> 2,5 <SEP> (s, <SEP> 3H)
 <tb> I-14 <SEP> 2-Methylbutyl <SEP> Methyl <SEP> SO₂-C₂H₅ <SEP> 2,4,6-F₃ <SEP> 6,95 <SEP> (t,
 <SEP> 2H) <SEP> ; <SEP> 3,6 <SEP> (q, <SEP> 2H) <SEP> ; <SEP> 2,5 <SEP> (s, <SEP> 3H)
 <tb>

<Desc/Cims Page number 63>

Anwendungsbeispiele Die Wirkstoffe wurden getrennt als Stammlösung formuliert mit 0,25Gew.-% Wirkstoff in Aceton oder DMSO. Dieser Lösung wurde 1Gew.-% EmulgatorUniperol@ EL (Netzmittel mit Emulgier-und Dispergierwirkung auf der Basis ethoxylierter Alkylphenole) zugesetzt. Die Stammlösungen der Wirkstoffe wurden entsprechend der angegebenen Konzentration mit Wasser verdünnt.

Beispiel 1 : Wirksamkeit gegen den Grauschimmel an Paprikablättern verursacht durch Botrytis cinerea bei protektiver Anwendung Paprikasämlinge der Sorte "Neusiedler IdealElite" wurden, nach- dem sich 4-5 Blätter gut entwickelt hatten, mit einer wässrigen Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Am nächsten Tag wurden die behandelten Pflanzen mit einer Sporensuspension von Botrytis cinerea, die 1.7 x 10⁶ Sporen/ml in einer 2%igen wässrigen Biomalzlösung enthielt, inokuliert. Anschliessend wurden die Versuchspflanzen in eine Klimakammer mit 22 bis 24 °C und hoher Luftfeuchtigkeit gestellt. Nach 5 Tagen konnte das Ausmass des Pilzbefalls auf den Blättern visuell in % ermittelt werden.

Bei diesem Test zeigten die mit 250 ppm der Verbindung I-2, I-11 und I-12 behandelten Pflanzen einen Befall zu < 40 %, während die unbehandelten (Kontroll-) pflanzen zu 90% vom Schadpilz befallen waren.

Beispiel 2 : Wirksamkeit gegen die Dürffleckenkrankheit der Tomate verursacht durch Alternaria solani Blätter von Topfpflanzen der Sorte "Goldene Prinzessin" wurden mit einer wässrigen Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Am folgenden Tag wurden die Blätter mit einer wässrigen Sporenaufschwemmung von Alternaria solani in 2% Biomalzlösung mit einer Dichte von 0.17 x 10⁶ Sporen/ml infiziert. Anschliessend wurden die Pflanzen in einer wasserdampf-gesättigten Kammer bei Temperaturen zwischen 20. und 22 °C aufgestellt. Nach 5 Tagen hatte sich die Krautfäule auf den unbehandelten, jedoch infizierten Kontrollpflanzen so stark entwickelt, dass der Befall visuell in % ermittelt werden konnte.

Bei diesem Test waren die mit 250 ppm der Verbindung I-11 behandelten Pflanzen zu < 10% befallen, während die unbehandelten (Kontroll-) pflanzen einen Befall von 80% zeigten.

Data supplied from the esp@cenet database - Worldwide

TRIAZOLOPYRIMIDINES, METHODS FOR THE PRODUCTION THEREOF, USE THEREOF FOR CONTROLLING HARMFUL FUNGI, AND SUBSTANCES CONTAINING SAID TRIAZOLOPYRIMIDINES

Claims of corresponding document: **WO2004058765**

Patentansprüche 1. Triazolopyrimidine der Formel I
EMI64.1

in der Index und die Substituenten die folgende Bedeutung haben : n 0 oder eine ganze Zahl von. 1 bis 5;
L Halogen, Cyano, Hydroxy, Cyanato (OCN), C1-C8-Alkyl, C2-Clo-Alkenyl, C2-Clo-Alkiny, C1-C6-Alkoxy,
C1-C10-Alkenyloxy, C2-C10-Alkinyloxy, C3-C6-Cycloalkyl, C3-C6-Cycloalkenyl, C3-C6-Cycloalkoxy, ein
fünf-bis-zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein
bis vier Heteroatome aus der

Gruppe 0, N oder S; -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A,

C(A')(=N-OA), N(A')A, N(A')-C(=O)-A, N(A'')-C(=O)-N(A')A, oder S(=O)m-A, m0,1 oder 2 ;

A, A', A'' unabhängig voneinander Wasserstoff,

C1-C6-Alkyl, C2-C6-Alkenyl, C2-C6-Alkiny, C3-C8-Cycloalkyl, C3-C6-Cycloalkenyl, wobei die organischen
Reste partiell oder vollständig halogeniert sein können oder durch Cyano oder C1-C4-Alkoxy substituiert
sein können ; R1 C1-C10-Alkyl, C2-Clo-Alkenyl, C2-Clo-Alkiny, C3-C12-Cycloalkyl, C3-Clo-Cycloalkenyl,
Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf-bis-zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer
über Kohlenstoff gebundener Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der
Gruppe 0, N oder S, wobei L und/oder R1 partiell oder vollständig halogeniert oder durch eine bis vier
gleiche oder verschiedene Gruppen Ra substituiert sein können :

Ra Halogen, Cyano, C1-C6-Alkyl, C3-C6-Cycloalkyl,

C5-C6-Cycloalkenyl, C1-C6-Alkoxy, C1-C6-Alkylthio,

C2-C6-Alkenyl, C2-C6-Alkenyloxy, C3-C6-Alkinyloxy,

<Desc/Cims Page number 65>

C2-Clo-Alkiny, Phenyl, Naphthyl, fünf-bis-zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe 0, N oder S; -C

R3 Halogen, Cyano, C1-C6-Alkyl, C1-C4-Halogenalkyl, Hydroxy,

C1-C8-Alkoxy, C3-C8-Alkenyl, C3-C8-Alkenyloxy, C1-C8-Halogenalkoxy, C3-C8-Halogenalkenyloxy, C3-C8-Cycloalkyl,

N(A')A, N(A')-C(=O)-A oder S(=O)m-A.

2. Triazolopyrimidine nach Anspruch 1 in der Index und die Substituenten die folgende Bedeutung haben :

L Halogen, Cyano, C1-C8-Alkyl, C2-C10-Alkenyl, C2-Clo-Alkiny, C1-C6-Alkoxy, C2-C10-Alkenyloxy, C2-Clo-Alkinyloxy, C3-C6-Cycloalkyl, C3-C6-Cycloalkenyl, C3-C6-Cycloalkoxy, -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A')(=N-OA),

N(A')A, N(A')-C(=O)-A, N(A'')-C(=O)-N(A')A, oder

S(=O)m-A, m0, 1 oder 2 ;

A, A', A'' unabhängig voneinander Wasserstoff, C1-C6-Alkyl, C2-C6-Alkenyl, C2-C6-Alkiny, C3-C8-Cycloalkyl, C3-C8-Cycloalkenyl, wobei die organischen

Reste partiell oder vollständig halogeniert sein können oder durch Cyano oder C1-C4-Alkoxy substituiert sein können ;

R1 C1-C10-Alkyl, C2-C10-Alkenyl, C2-C10-Alkiny, C3-C12-Cycloalkyl, C3-C10-Cycloalkenyl oder ein fünf-bis-zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer über Kohlenstoff gebundener Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe 0, N oder S, wobei L und/oder R1 partiell oder vollständig halogeniert oder durch eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen Ra substituiert sein können :

Ra Halogen, Cyano, C1-C6-Alkyl, C3-C6-Cycloalkyl, C5-C6-Cycloalkenyl, C1-C6-Alkoxy, C1-C6-Alkylthio, C2-C6-Alkenyl, C2-C6-Alkenyloxy, C3-C6-Alkinyloxy, C2-Clo-Alkiny, Phenyl, Naphthyl, fünf-bis-zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe 0, N oder S ; -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A')(=N-OA), N(A')A,

A,

N (A')-C(=O)-A, N (A'')-C(=O)-N (A') A, oder S(=O)m-A,

<Desc/Cims Page number 67>

wobei diese aliphatischen, alicyclischen oder aroma- tischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen Rb tragen können :Rb Halogen, Cyano, Nitro, Aminocarbonyl, Aminothio- carbonyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkylsulfonyl, Al- kylsulfoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten und die genannten Alkenyl-oder Alkinylgruppen in diesen Resten 2 bis 8 Kohlenstoffatome enthalten ; und/oder einen bis drei der folgenden Reste :

Cycloalkyl, Cycloalkoxy, Heterocyclyl, Hetero- cyclolyoxy, wobei die cyclischen Systeme 3 bis 10 Ringglieder enthalten ; Aryl-, Aryloxy, Arylthio, Aryl-Cl-C6-alkoxy, Aryl-Cl-C6-alkyl, Hetaryl, Hetaryloxy, Hetarylthio, wobei die Arylreste vorzugsweise 6 bis 10 Ringglieder, die Hetaryl- reste 5

C2-Cl0-Alkyl, -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N (A') A,

C (A') (=N-OA), N (A')A, N (A')-C(=O)-A,

N (A'')-C(=O)-N (A') A, oder S(=O)m-A, wobei diese aliphatischen, alicyclischen oder aroma- tischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen Rb tragen können :Rb Halogen, Cyano, Aminocarbonyl, Alkyl, Haloalkyl,

Alkenyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Alkoxy, Haloge-nalkoxy, Alkylcarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsul- foxy, Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkyla- minocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten 1 bis 6 Kohlen- stoffatome enthalten und die genannten Alkenyl- oder Alkinylgruppen in diesen Resten 2 bis

8 Kohlenstoffatome enthalten ;

R2Cl-C4-Alkyl, das durch Halogen, Cyano, Nitro, Cl-C2-Alkoxy oder Cl-C4-Alkoxycarbonyl substituiert seinkann..

4. Verbindungen der Formel 1 nach Anspruch 1, in der R3 S(=O)m-A bedeutet.

5. Verbindungen der Formel I nach Anspruch 1, in der R3 SH bedeu- tet.

6. Verbindungen der Formel 1 nach Anspruch 1, in der R2 Methyl bedeutet.

7. Verbindungen der Formel I nach einem der Ansprüche 1 bis 4, in der die durch Ln substituierte Phenylgruppe für die Gruppe B

EMI68.1

steht, worin # die Verknüpfungsstelle mit dem Triazolopyrimi- din-Gerüst ist und L1 Fluor, Chlor, CH3 oder CF3 ; L2, L4 unabhängig voneinander Wasserstoff, CH3 oder Fluor ; L3 Wasserstoff, Fluor, Chlor, Cyano, CH3, SCH3, OCH3,

SO2CH3, NH-C(=O) CH3, N (CH3)-C(=O) CH3 oder COOCH3 und

<Desc/Cims Page number 69>

L5 Wasserstoff, Fluor, Chlor oder CH3 bedeuten.

8. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel 1 gemäss Anspruch 1 durch Umsetzung von Sulfonen der Formel I',

EMI69.1

in der R für Cl-C6-Alkyl oder ggf. substituiertes Phenyl steht, mit Verbindungen der Formel III,

EMI69.2

in der R3 die für Formel 1 gegebene Bedeutung hat und M für ein Ammonium-, Tetraalkylammonium-, Alkali- oder Erdalkalime- tallkation, und wenn R3 Cl-C8-Alkyl oder Cl-C4-Halogenalkyl bedeutet für ein Metallion der Wertigkeit Y ausgewählt aus der Gruppe: B, Zn, Mg, Si oder Sn steht, unter basischen Be- dingungen.

9. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäss

Anspruch I, durch Umsetzung von Triazolen der Formel IIIa

EMI69.3

in der R für Wasserstoff, Cl-C6-Alkyl oder ggf. substituiertes Phenyl steht, mit Dicarbonylverbindungen der Formel IV,

EMI69.4

in der n, L, R1 und R2 die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben, zu Triazolopyrimidinsulfiden der Formel I",

EMI69.5

und ggf. Oxidation von I" zu Sulfonen der Formel I' gemäß Anspruch 8.

10. Zur Bekämpfung von Schadpilzen geeignetes Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und eine Verbindung der Formel 1 gemäß Anspruch 1.

<Desc/Cims Page number 70>

11. Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pilze oder die vor Pilz- befall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 behandelt.

Data supplied from the **esp@cenet** database - Worldwide